


**Prioritätsbescheinigung über die Einreichung
einer Patentanmeldung**

 **Aktenzeichen:** 103 17 898.8

Anmeldetag: 17. April 2003

Anmelder/Inhaber: BASF Aktiengesellschaft, 67063 Ludwigshafen/DE

Bezeichnung: Bicyclische Verbindungen und ihre Verwendung
zur Bekämpfung von Schadpilzen

IPC: C 07 D, A 01 N



Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.

München, den 22. April 2004
Deutsches Patent- und Markenamt
Der Präsident
Im Auftrag

faust

Bicyclische Verbindungen und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen

Beschreibung

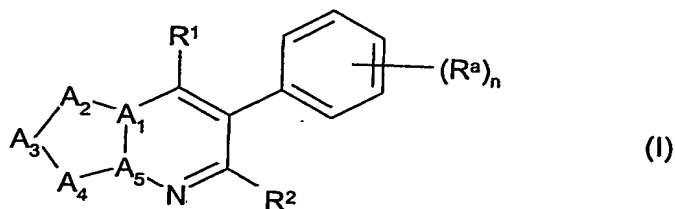
5 Die vorliegende Erfindung betrifft neue, bicyclische Verbindungen und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie Pflanzenschutzmittel, die derartige Verbindungen als wirksamen Bestandteil enthalten.

10 Die EP-A 71792, US 5,994,360, EP-A 550113, WO 02/48151 beschreiben fungizid wirksame Pyrazolo[1,5-a]pyrimidine und Triazolo[1,5a]pyrimidine, die in der 5-Position des Pyrimidinrings eine gegebenenfalls substituierte Phenylgruppe tragen. Aus der WO 03/022850 sind Imidazolo[1,2-a]pyrimidine mit fungizider Wirkung bekannt.

15 Die EP-A 770615 beschreibt ein Verfahren zur Herstellung von 5-Arylazolopyrimidinen, die in der 4- und in der 6-Position des Pyrimidinrings ein Chlor- oder Bromatom aufweisen.

20 Die aus dem Stand der Technik bekannten Azolopyrimidine sind hinsichtlich ihrer fungiziden Wirkung teilweise nicht zufriedenstellend oder besitzen unerwünschte Eigenschaften, wie eine geringe Nutzpflanzenverträglichkeit.

25 Der vorliegenden Erfindung liegt daher die Aufgabe zugrunde, neue Verbindungen mit besserer fungizider Wirksamkeit und/oder einer besseren Nutzpflanzenverträglichkeit bereitzustellen. Diese Aufgabe wird gelöst durch bicyclische Verbindungen der allgemeinen Formel I



worin

- 30 A₁ oder A₅ für C steht und die andere der beiden Variablen A₁, A₅ für N, C oder C-R³ steht;
 A₂, A₃, A₄ unabhängig voneinander für N oder C-R^{3a} stehen,
 wobei eine der Variablen A₂, A₃ oder A₄ auch für S oder eine Gruppe N-R⁴ stehen kann, wenn A₁ und A₅ beide für C stehen, worin
 35 A₁ mit A₂ und A₃ mit A₄ oder
 A₂ mit A₃ und A₄ mit A₅ oder
 A₁ mit A₅ und A₂ mit A₃ oder
 A₁ mit A₅ und A₃ mit A₄ oder

2

- A_1 mit A_2 und A_4 mit A_5 durch Doppelbindungen miteinander verbunden sind;
- n für 0, 1, 2, 3, 4 oder 5 steht;
- 5 R^a für Halogen, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_1 - C_6 -Haloalkoxy, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy oder $C(O)R^5$ steht;
- R^1 Halogen, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkiny, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_5 - C_8 -Cycloalkenyl, OR^6 , SR^6 oder NR^7R^8 bedeuten;
- R^2 Halogen, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkiny, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_5 - C_8 -Cycloalkenyl, OR^6 , SR^6 oder NR^7R^8 bedeuten;
- 10 R^3 , R^{3a} unabhängig voneinander für Wasserstoff, CN, Halogen, C_1 - C_6 -Alkyl oder C_2 - C_6 -Alkenyl stehen;
- R^4 Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl oder C_2 - C_6 -Alkenyl bedeutet;
- R^5 Wasserstoff, OH, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_1 - C_6 -Haloalkoxy, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_1 - C_6 -Alkylamino oder Di- C_1 - C_6 -alkylamino, Piperidin-1-yl, Pyrrolidin-1-yl oder Morpholin-4-yl bedeutet;
- 15 R^6 Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl oder COR^9 bedeutet;
- R^7 , R^8 unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_4 - C_{10} -Alkadienyl, C_2 - C_{10} -Alkiny, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_5 - C_8 -Cycloalkenyl, C_5 - C_{10} -Bicycloalkyl, Phenyl, Naphthyl,
- 20 ein 5- oder 6-gliedriger, gesättigter oder teilweise ungesättigter Heterocyclus, der 1, 2 oder 3 Heteroatome, ausgewählt unter N, O und S, als Ringglieder aufweisen kann, oder
- 25 ein 5- oder 6-gliedriger, aromatischer Heterocyclus, der 1, 2 oder 3 Heteroatome, ausgewählt unter N, O und S, als Ringglieder aufweisen kann, wobei die als R^7 , R^8 genannten Reste teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1, 2 oder 3 Reste R^b aufweisen können, wobei R^b ausgewählt ist unter Cyano, Nitro, OH, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_1 - C_6 -Haloalkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, C_2 - C_6 -Alkiny, C_2 - C_6 -Alkinyloxy, C_1 - C_6 -Alkylamino, Di- C_1 - C_6 -alkylamino, Piperidin-1-yl, Pyrrolidin-1-yl oder Morpholin-4-yl;
- 30 R^7 mit R^8 auch gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-, 6 oder 7-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus bilden können, der 1, 2, 3 oder 4 weitere Heteroatome, ausgewählt unter O, S, N und NR^{10} als Ringglied aufweisen kann, der teilweise oder vollständig halogeniert sein kann und der 1, 2 oder 3 der Reste R^b aufweisen kann; und
- 35 R^9 , R^{10} unabhängig voneinander Wasserstoff oder C_1 - C_6 -Alkyl bedeuten; wobei A_1 nicht für N steht, wenn A_5 für C steht und gleichzeitig A_2 , A_3 und A_4 die folgenden Bedeutungen aufweisen: A_2 steht für N oder $C-R^{3a}$, A_3 steht für $C-R^{3a}$ und A_4 steht für N oder $C-R^{3a}$;
- 40 sowie die landwirtschaftlich verträglichen Salze von Verbindungen I.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind somit die bicyclische Verbindungen der allgemeinen Formel I und deren landwirtschaftlich verträglichen Salze, ausgenommen

M/43373

3

Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin R^1 und R^2 gleichzeitig für OH oder gleichzeitig für Halogen stehen, wenn A_1 für N und A_5 für C stehen und die Variablen A_2 , A_3 und A_4 unabhängig voneinander N oder C- R^{3a} bedeuten.

- 5 Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist weiterhin die Verwendung der bicyclischen Verbindungen der allgemeinen Formel I und ihrer landwirtschaftlich verträglichen Salze zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen (=Schadpilzen) sowie ein Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, das dadurch gekennzeichnet ist, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, 10 den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der allgemeinen Formel I und/oder mit einem landwirtschaftlich verträglichen Salz von I behandelt.

- 15 Gegenstand der vorliegenden Erfindung Mittel zur Bekämpfung von Schadpilzen, enthaltend wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel I und oder ein landwirtschaftlich verträgliches Salz davon und wenigstens einen flüssigen oder festen Trägerstoff.

- 20 Die Verbindungen der Formel I können je nach Substitutionsmuster ein oder mehrere Chiralitätszentren aufweisen und liegen dann als Enantiomeren- oder Diastereomeren-gemische vor. Gegenstand der Erfindung sind sowohl die reinen Enantiomere oder Diastereomere als auch deren Gemische. Gegenstand der Erfindung sind auch Tautomere von Verbindungen der Formel I.

- 25 Unter landwirtschaftlich brauchbaren Salzen kommen vor allem die Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen Säuren in Betracht, deren Kationen beziehungsweise Anionen die fungizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchtigen. So kommen als Kationen insbesondere die Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium, Magnesium und Barium, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und 30 Eisen, sowie das Ammoniumion, das gewünschtenfalls ein bis vier C_1 - C_4 -Alkylsubstituenten und/oder einen Phenyl- oder Benzylsubstituenten tragen kann, vorzugsweise Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise $Tri(C_1-C_4\text{-alkyl})$ sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise $Tri(C_1-C_4\text{-alkyl})$ sulfoxonium, in Betracht. 35

- Anionen von brauchbaren Säureadditionssalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Phosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat, 40 sowie die Anionen von C_1 - C_4 -Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat. Sie können durch Reaktion von I mit einer Säure des entsprechenden Anions, vorzugsweise der Chlorwasserstoffsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure oder Salpetersäure, gebildet werden.

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Variablen werden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die jeweiligen Substituenten stehen. Die Bedeutung C_n - C_m gibt die jeweils mögliche Anzahl von Kohlenstoffatomen in dem jeweiligen Substituenten oder Substituententeil an:

5

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

Alkyl sowie alle Alkylteile in Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino und Dialkylamino: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, bis 6, bis 8 oder bis 10 Kohlenstoffatomen, z.B. C_1 - C_6 -Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

15

Halo(gen)alkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 4 oder bis 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B. C_1 - C_2 -Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl und 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;

20

25

Alkenyl: einfach ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, bis 6 bis 8 oder bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C_2 - C_6 -Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-

30

35

40

butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

5

Alkadienyl: zweifach ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 4 bis 10 Kohlenstoffatomen und zwei Doppelbindungen in einer beliebigen Position z.B. 1,3-Butadienyl, 1-Methyl-1,3-butadienyl, 2-Methyl-1,3-butadienyl, Penta-1,3-dien-1-yl, Hexa-1,4-dien-1-yl, Hexa-1,4-dien-3-yl, Hexa-1,4-dien-6-yl, Hexa-1,5-dien-1-yl, Hexa-1,5-dien-3-yl, Hexa-1,5-dien-4-yl, Hepta-1,4-dien-1-yl, Hepta-1,4-dien-3-yl, Hepta-1,4-dien-6-yl, Hepta-1,4-dien-7-yl, Hepta-1,5-dien-1-yl, Hepta-1,5-dien-3-yl, Hepta-1,5-dien-4-yl, Hepta-1,5-dien-7-yl, Hepta-1,6-dien-1-yl, Hepta-1,6-dien-3-yl, Hepta-1,6-dien-4-yl, Hepta-1,6-dien-5-yl, Hepta-1,6-dien-2-yl, Octa-1,4-dien-1-yl, Octa-1,4-dien-2-yl, Octa-1,4-dien-3-yl, Octa-1,4-dien-6-yl, Octa-1,4-dien-7-yl, Octa-1,5-dien-1-yl, Octa-1,5-dien-3-yl, Octa-1,5-dien-4-yl, Octa-1,5-dien-7-yl, Octa-1,6-dien-1-yl, Octa-1,6-dien-3-yl, Octa-1,6-dien-4-yl, Octa-1,6-dien-5-yl, Octa-1,6-dien-2-yl, Deca-1,4-dienyl, Deca-1,5-dienyl, Deca-1,6-dienyl, Deca-1,7-dienyl, Deca-1,8-dienyl, Deca-2,5-dienyl, Deca-2,6-dienyl, Deca-2,7-dienyl, Deca-2,8-dienyl und dergleichen;

10

15

Alkynyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 2 bis 6 2 bis 8 oder 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. C_2 - C_6 -Alkynyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

25

30

Cycloalkyl: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 8, vorzugsweise bis 6 Kohlenstoffringgliedern, wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl;

35

Cycloalkenyl: monocyclische, einfach ungesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 5 bis 8, vorzugsweise bis 6 Kohlenstoffringgliedern, wie Cyclopenten-1-yl, Cyclopenten-3-yl, Cyclohexen-1-yl, Cyclohexen-3-yl und Cyclohexen-4-yl;

40

Bicycloalkyl: bicyclischer Kohlenwasserstoffrest mit 5 bis 10 C-Atomen wie Bicyclo[2.2.1]hept-1-yl, Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl, Bicyclo[2.2.1]hept-7-yl, Bicyclo[2.2.2]oct-1-yl, Bicyclo[2.2.2]oct-2-yl, Bicyclo[3.3.0]octyl und Bicyclo[4.4.0]decyl.

C₁-C₄-Alkoxy für eine über ein Sauerstoff gebundene Alkylgruppe mit 1 bis 4 C-Atomen: z. B. Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 1-Methylethoxy, Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy oder 1,1-Dimethylethoxy;

- 5 **C₁-C₆-Alkoxy:** für C₁-C₄-Alkoxy, wie voranstehend genannt, sowie z. B. Pentoxy, 1-Methylbutoxy, 2-Methylbutoxy, 3-Methylbutoxy, 1,1-Dimethylpropoxy, 1,2-Dimethylpropoxy, 2,2-Dimethylpropoxy, 1-Ethylpropoxy, Hexoxy, 1-Methylpentoxy, 2-Methylpentoxy, 3-Methylpentoxy, 4-Methylpentoxy, 1,1-Dimethylbutoxy, 1,2-Dimethylbutoxy, 1,3-Dimethylbutoxy, 2,2-Dimethylbutoxy, 2,3-Dimethylbutoxy, 3,3-Dimethylbutoxy, 1-Ethylbutoxy, 2-Ethylbutoxy, 1,1,2-Trimethylpropoxy, 1,2,2-Trimethylpropoxy, 1-Ethyl-1-methylpropoxy oder 1-Ethyl-2-methylpropoxy;

- 15 **C₁-C₄-Halogenalkoxy:** für einen C₁-C₄-Alkoxyrest wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod, vorzugsweise durch Fluor substituiert ist, also z.B. OCH₂F, OCHF₂, OCF₃, OCH₂Cl, OCHCl₂, OCCl₃, Chlorfluormethoxy, Dichlorfluormethoxy, Chlordifluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy, 2-Bromethoxy, 2-Iodethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2-fluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy, OC₂F₅, 2-Fluorpropoxy, 3-Fluorpropoxy, 2,2-Difluorpropoxy, 2,3-Difluorpropoxy, 20 2-Chlorpropoxy, 3-Chlorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 2-Brompropoxy, 3-Brompropoxy, 3,3,3-Trifluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy, OCH₂-C₂F₅, OCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluorethoxy, 1-(CH₂Cl)-2-chlorethoxy, 1-(CH₂Br)-2-bromethoxy, 4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy oder Nonafluorbutoxy;
- 25 **C₁-C₆-Halogenalkoxy:** für C₁-C₄-Halogenalkoxy, wie voranstehend genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentoxy, 5-Chlorpentoxy, 5-Brompentoxy, 5-Iodpentoxy, Undecafluorpentoxy, 6-Fluorhexoxy, 6-Chlorhexoxy, 6-Bromhexoxy, 6-Iodhexoxy oder Dodecafluorhexoxy;

- 30 **Alkenyloxy:** Alkenyl wie vorstehend genannt, das über ein Sauerstoffatom gebunden ist, z.B. C₂-C₆-Alkenyloxy wie Vinyloxy, 1-Propenyloxy, 2-Propenyloxy, 1-Methylethenyloxy, 1-Butenyloxy, 2-Butenyloxy, 3-Butenyloxy, 1-Methyl-1-propenyloxy, 2-Methyl-1-propenyloxy, 1-Methyl-2-propenyloxy, 2-Methyl-2-propenyloxy, 1-Pentenyloxy, 2-Pentenyloxy, 3-Pentenyloxy, 4-Pentenyloxy, 1-Methyl-1-butenyloxy, 2-Methyl-1-butenyloxy, 3-Methyl-1-butenyloxy, 1-Methyl-2-butenyloxy, 2-Methyl-2-butenyloxy, 3-Methyl-2-butenyloxy, 1-Methyl-3-butenyloxy, 2-Methyl-3-butenyloxy, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyloxy, 1,2-Dimethyl-1-propenyloxy, 1,2-Dimethyl-2-propenyloxy, 1-Ethyl-1-propenyloxy, 1-Ethyl-2-propenyloxy, 1-Hexenyloxy, 2-Hexenyloxy, 3-Hexenyloxy, 4-Hexenyloxy, 5-Hexenyloxy, 1-Methyl-1-pentenyloxy, 2-Methyl-1-pentenyloxy, 3-Methyl-1-pentenyloxy, 4-Methyl-1-pentenyloxy, 1-Methyl-2-pentenyloxy, 2-Methyl-2-pentenyloxy, 3-Methyl-2-pentenyloxy, 4-Methyl-2-pentenyloxy, 1-Methyl-3-pentenyloxy, 2-Methyl-3-pentenyloxy, 3-Methyl-3-pentenyloxy, 4-Methyl-3-pentenyloxy, 1-Methyl-4-pentenyloxy, 2-Methyl-4-pentenyloxy, 3-Methyl-4-pentenyloxy, 4-Methyl-4-pentenyloxy, 1,1-Dimethyl-2-butenyloxy, 1,1-Dimethyl-3-butenyloxy, 1,2-

Dimethyl-1-butenyloxy, 1,2-Dimethyl-2-butenyloxy, 1,2-Dimethyl-3-butenyloxy, 1,3-Dimethyl-1-butenyloxy, 1,3-Dimethyl-2-butenyloxy, 1,3-Dimethyl-3-butenyloxy, 2,2-Dimethyl-3-butenyloxy, 2,3-Dimethyl-1-butenyloxy, 2,3-Dimethyl-2-butenyloxy, 2,3-Dimethyl-3-butenyloxy, 3,3-Dimethyl-1-butenyloxy, 3,3-Dimethyl-2-butenyloxy, 1-Ethyl-1-butenyloxy, 1-Ethyl-2-butenyloxy, 1-Ethyl-3-butenyloxy, 2-Ethyl-1-butenyloxy, 2-Ethyl-2-butenyloxy, 2-Ethyl-3-butenyloxy, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyloxy, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyloxy, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyloxy und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyloxy;

- 10 **Alkinyloxy:** Alkynyl wie vorstehend genannt, das über ein Sauerstoffatom gebunden ist, z.B. C₃-C₆-Alkinyloxy wie 2-Propinyloxy, 2-Butinyloxy, 3-Butinyloxy, 1-Methyl-2-propinyloxy, 2-Pentinyloxy, 3-Pentinyloxy, 4-Pentinyloxy, 1-Methyl-2-butinyloxy, 1-Methyl-3-butinyloxy, 2-Methyl-3-butinyloxy, 1-Ethyl-2-propinyloxy, 2-Hexinyloxy, 3-Hexinyloxy, 4-Hexinyloxy, 5-Hexinyloxy, 1-Methyl-2-pentinyloxy, 1-Methyl-3-pentinyloxy und dergleichen;

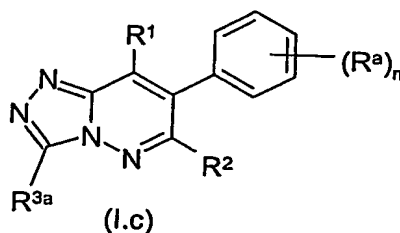
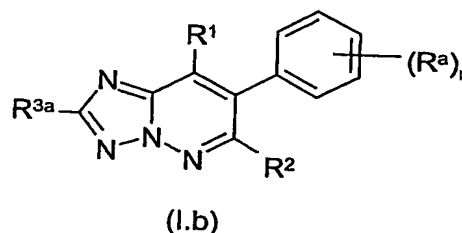
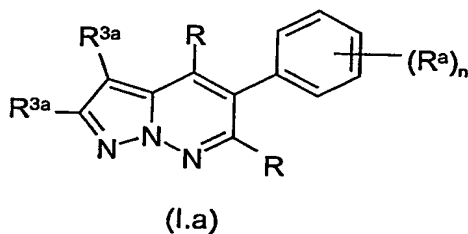
- fünf- oder sechsgliedriger gesättigtes oder partiell ungesättigter Heterocyclus, enthaltend ein, zwei oder drei Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel:** z.B. mono- und bicyclische Heterocyclen (Heterocyclyl) enthaltend neben Kohlenstoffringgliedern ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isloxazolidinyl, 4-Isloxazolidinyl, 5-Isloxazolidinyl, 3-Isythiazolidinyl, 4-Isythiazolidinyl, 5-Isythiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofur-2-yl, 2,3-Dihydrofur-3-yl, 2,4-Dihydrofur-2-yl, 2,4-Dihydrofur-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Isloxazolin-3-yl, 3-Isloxazolin-3-yl, 4-Isloxazolin-3-yl, 2-Isloxazolin-4-yl, 3-Isloxazolin-4-yl, 4-Isloxazolin-4-yl, 2-Isloxazolin-5-yl, 3-Isloxazolin-5-yl, 4-Isloxazolin-5-yl, 2-Isythiazolin-3-yl, 3-Isythiazolin-3-yl, 4-Isythiazolin-3-yl, 2-Isythiazolin-4-yl, 3-Isythiazolin-4-yl, 4-Isythiazolin-4-yl, 2-Isythiazolin-5-yl, 3-Isythiazolin-5-yl, 4-Isythiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydropyrazol-2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-

M/43373

Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl, 2-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydro-triazin-2-yl und 1,2,4-Hexahydrotriazin-3-yl;

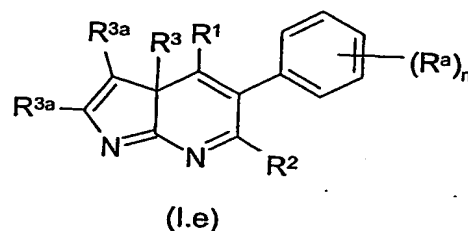
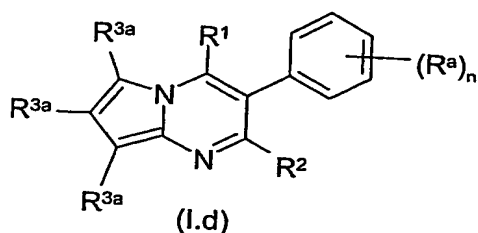
- 5 **fünf- bis sechsgliedriger aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein, zwei oder drei Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel:** ein- oder zweikerniges Heteroaryl, z.B. C-gebundenes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder wie 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isloxazolyl, 4-Isloxazolyl, 5-Isloxazolyl, 3-Isythiazolyl, 4-Isythiazolyl, 5-Isythiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl; über Stickstoff gebundenes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome als Ringglieder wie Pyrrol-1-yl, Pyrazol-1-yl, Imidazol-1-yl, 1,2,3-Triazol-1-yl und 1,2,4-Triazol-1-yl; 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome ein bis drei Stickstoffatome als Ringglieder wie Pyridin-2-yl, Pyridin-3-yl, Pyridin-4-yl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl;

Eine erste bevorzugte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I, worin A₁ mit A₂ sowie A₃ mit A₄ jeweils durch eine Doppelbindung miteinander verbunden sind. In der Regel stehen dann A₁ für C und A₅ für N. Die verbleibenden Gruppen A₂, A₃ und A₄ stehen dann unabhängig voneinander für N oder C-R^{3a}. Hierzu zählen beispielsweise die Verbindungen der allgemeinen Formeln I.a, I.b und I.c:

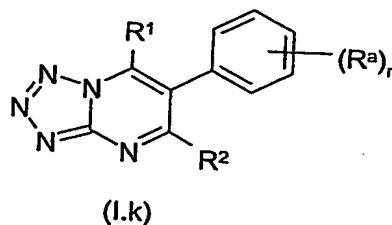
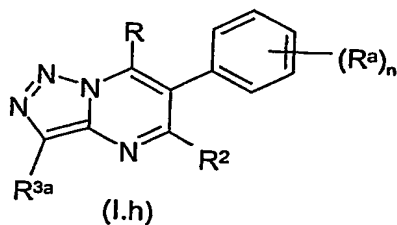
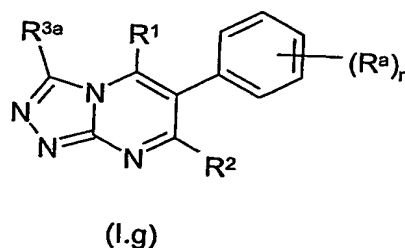
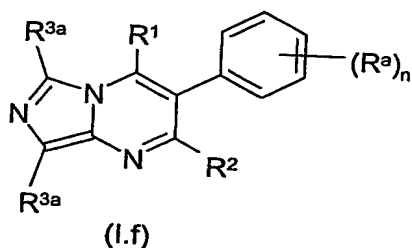


Hierunter sind Verbindungen bevorzugt, worin A_1 für C steht, A_2 und A_5 für N stehen und die verbleibenden Gruppen A_3 und A_4 unabhängig voneinander N oder C- R^{3a} bedeuten, z.B. die Verbindungen der Formeln I.b und I.c.

- 5 Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I, worin A_2 mit A_3 sowie A_4 mit A_5 jeweils durch eine Doppelbindung miteinander verbunden sind. In der Regel stehen dann A_1 für N oder C- R^3 und A_5 für C. Beispiele hierfür sind Verbindungen I, worin A_2 und A_3 für C- R^{3a} stehen und A_4 N oder C- R^{3a} bedeuten, beispielsweise die Verbindungen der Formeln I.d und I.e. A_1 steht vorzugsweise für N.



- 15 Unter den Verbindungen der Formel I, worin A_2 mit A_3 und A_4 mit A_5 jeweils durch eine Doppelbindung miteinander verbunden sind, A_1 für N und A_5 für C stehen, sind solche Verbindungen bevorzugt, worin A_3 für N steht und A_2 und A_4 unabhängig voneinander C- R^{3a} oder N bedeuten. Hierzu zählen beispielsweise die Verbindungen der Formeln I.f, I.g, I.h und I.k:

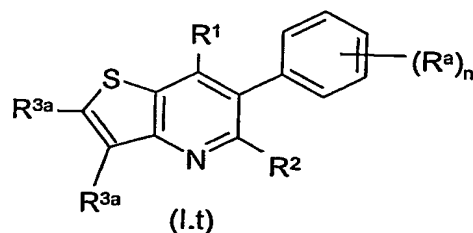
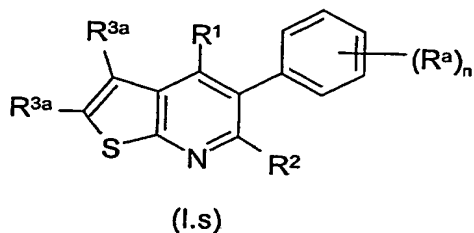
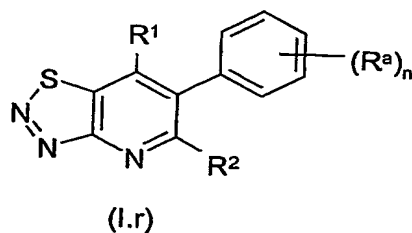
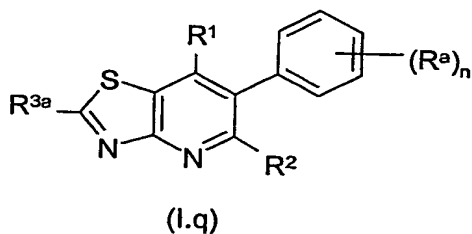
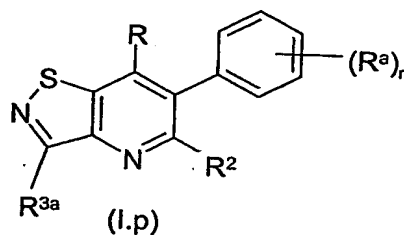
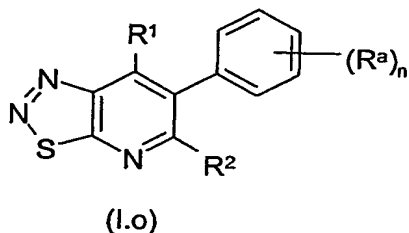
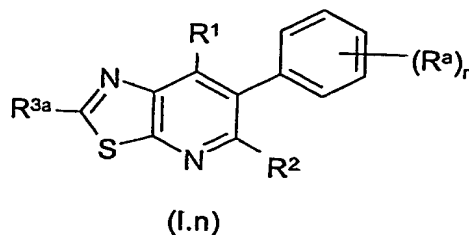
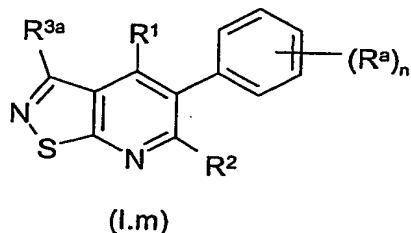


- 25 Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der vorliegenden Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I, worin A_1 mit A_5 und A_2 mit A_3 oder A_1 mit A_5 und A_3 mit A_4 jeweils durch eine Doppelbindung miteinander verbunden sind. In der Regel stehen dann

10

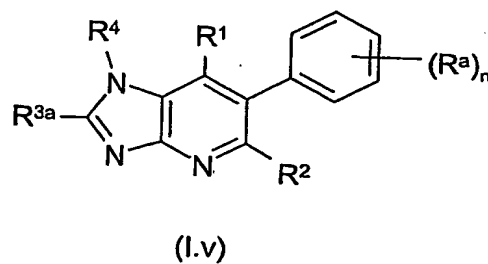
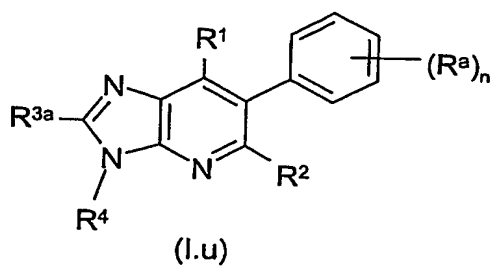
A₁ und A₅ für C. Hierunter bevorzugt sind Verbindungen I, worin eine der Variablen A₂, oder A₄ für S und die verbleibenden Variablen A₂, A₃ und A₄ unabhängig voneinander für N oder C-R^{3a} stehen, beispielsweise die Verbindungen der Formeln I.m, I.n, I.o, I.p, I.q, I.r, I.s und I.t.

5



10

Hierunter bevorzugt sind auch Verbindungen I, worin eine der Variablen A₂ oder A₄ für N-R⁴ steht und die verbleibenden Variablen A₂, A₃ und A₄ unabhängig voneinander für N oder C-R^{3a} stehen, beispielsweise die Verbindungen der Formeln I.u und I.v.



15

In den Formeln I.a bis I.v haben die Variablen R^a , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^{3a} und R^4 die zuvor genannten Bedeutungen, insbesondere die im Folgenden als bevorzugt angegebenen Bedeutungen.

5

Im Hinblick auf die Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen I als Fungizide weisen die Variablen n , R^a , R^1 und R^2 unabhängig voneinander und vorzugsweise in Kombination die folgenden Bedeutungen auf:

10 n 1, 2, 3 oder 4, insbesondere 2, oder 3;

15

R^a Halogen, insbesondere Fluor oder Chlor, C_1 - C_4 -Alkyl, insbesondere Methyl, Alkoxy, insbesondere Methoxy, C_1 - C_2 -Fluoralkyl insbesondere Difluormethyl und Trifluormethyl, und C_1 - C_2 -Fluoralkox, insbesondere Difluormethoxy und Trifluormethoxy. Besonders bevorzugt ist R^a ausgewählt unter Halogen, speziell Fluor oder Chlor, C_1 - C_4 -Alkyl, speziell Methyl, und C_1 - C_4 -Alkoxy, speziell Methoxy.

20

R^1 C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkenyl oder insbesondere eine Gruppe NR^7R^8 .

R^2 Halogen, speziell Chlor, oder C_1 - C_4 -Alkyl, speziell Methyl.

25

Sofern R^1 für C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyl oder C_2 - C_6 -Alkynyl steht, bedeutet R^2 vorzugsweise C_1 - C_4 -Alkyl und speziell Methyl.

Sofern R^1 für eine Gruppe NR^7R^8 steht, ist R^2 vorzugsweise ausgewählt unter Chlor und C_1 - C_4 -Alkyl und speziell unter Chlor und Methyl.

30

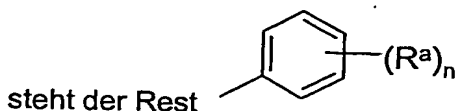
Sofern R^1 für eine Gruppe NR^7R^8 steht, ist vorzugsweise wenigstens einer der Reste R^7 , R^8 von Wasserstoff verschieden. Insbesondere steht R^7 für C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl oder C_2 - C_6 -Alkynyl. R^8 steht insbesondere für Wasserstoff oder C_1 - C_6 -Alkyl.

35

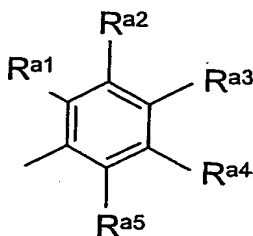
Zu den bevorzugten Gruppen NR^7R^8 zählen auch solche, die für einen gesättigten oder teilweise ungesättigten heterocyclischen Rest stehen, der neben dem Stickstoffatom 1 weiteres Heteroatom, ausgewählt unter O, S, und NR^{10} als Ringglied aufweisen kann, und der 1 oder 2 Substituenten aufweisen kann, die ausgewählt sind unter C_1 - C_6 -Alkyl und C_1 - C_6 -Haloalkyl. Vorzugsweise weist der heterocyclische Rest 5 bis 7 Atome als Ringglieder auf. Beispiele für derartige heterocyclische Reste sind Pyrrolidin, Piperidin, Morpholin, Tetrahydropyridin, z.B. 1,2,3,6 Tetrahydropyridin, Piperazin und Azepan, die in der vorgenannten Weise substituiert sein können.

40

Im Hinblick auf die Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen I als Fungizide



vorzugsweise für einen Rest der Formel



5

worin

R^{a1} für Fluor, Chlor oder Methyl;

R^{a2} für Wasserstoff oder Fluor;

R^{a3} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, C_1 - C_4 -Alkyl, speziell Methyl, oder C_1 - C_4 -Alkoxy, speziell Methoxy;

R^{a4} für Wasserstoff oder Fluor;

R^{a5} für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder C_1 - C_4 -Alkyl, speziell Methyl, stehen.

10

15

Hierbei ist wenigstens einer der Reste R^{a3} , R^{a5} von Wasserstoff verschieden. Insbesondere steht wenigstens einer und besonders bevorzugt beide Reste R^{a3} , R^{a5} für Wasserstoff.

20

Im Übrigen weisen die Variablen R^3 , R^4 , R^5 und R^6 unabhängig voneinander und vorzugsweise in Kombination mit den bevorzugten Bedeutungen der Variablen n , R^a , R^1 und R^2 die folgenden Bedeutungen auf:

R^3 Wasserstoff;

R^{3a} Wasserstoff;

R^4 C_1 - C_4 -Alkyl;

R^5 Wasserstoff, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy;

R^6 Wasserstoff, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Alkylcarbonyl.

25

30

35

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind die Verbindungen der allgemeinen Formel I.c, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Fluor-6-chlor steht (Verbindungen I.c.1). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.c.1 worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.c.1, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.c, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,6-Difluor steht (Verbindungen I.c.2). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.c.2, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.c.2, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.c, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,6-Dichlor steht (Verbindungen I.c.3). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.c.3, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.c.3, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.c, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Fluor-6-methyl steht (Verbindungen I.c.4). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.c.4, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.c.4, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.c, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,4,6-Trifluor steht (Verbindungen I.c.5). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.c.5, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.c.5, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.c, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,6-Difluor-4-methoxy steht (Verbindungen I.c.6). Beispiele hierfür sind Verbindun-

gen I.c.6, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.c.6, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.c, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Methyl-4-fluor steht (Verbindungen I.c.7). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.c.7, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.c.7, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.c, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Fluor steht (Verbindungen I.c.8). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.c.8, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.c.8, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.c, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Chlor steht (Verbindungen I.c.9). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.c.9, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.c.9, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.c, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,4-Difluor steht (Verbindungen I.c.10). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.c.10, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.c.10, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam

sam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

- 5 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.c, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Fluor-4-chlor steht (Verbindungen I.c.11). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.c.11, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch
- 10 Verbindungen I.c.11, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

- 15 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.c, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Chlor-4-fluor steht (Verbindungen I.c.12). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.c.12, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch
- 20 Verbindungen I.c.12, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

- 25 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.c, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Methyl steht (Verbindungen I.c.13). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.c.13, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Ver-
- 30 bindungen I.c.13, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

- 35 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.c, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,4-Dimethyl steht (Verbindungen I.c.14). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.c.14, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch
- 40 Verbindungen I.c.14, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.c, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Fluor-4-methyl steht (Verbindungen I.c.15). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.c.15, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.c.15, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.c, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,6-Dimethyl steht (Verbindungen I.c.16). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.c.16, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.c.16, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind die Verbindungen der allgemeinen Formel I.g, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Fluor-6-chlor steht (Verbindungen I.g.1). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.g.1 worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.g.1, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.g, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,6-Difluor steht (Verbindungen I.g.2). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.g.2, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.g.2, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.g, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,6-Dichlor steht (Verbindungen I.g.3). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.g.3, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in

einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.g.3, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

10 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.g, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Fluor-6-methyl steht (Verbindungen I.g.4). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.g.4, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.g.4, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

20 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.g, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,4,6-Trifluor steht (Verbindungen I.g.5). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.g.5, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.g.5, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

30 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.g, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,6-Difluor-4-methoxy steht (Verbindungen I.g.6). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.g.6, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.g.6, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

40 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.g, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Methyl-4-fluor steht (Verbindungen I.g.7). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.g.7, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.g.7, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

sam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

5 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.g, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Fluor steht (Verbindungen I.g.8). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.g.8, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.g.8, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

15 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.g, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Chlor steht (Verbindungen I.g.9). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.g.9, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.g.9, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

25 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.g, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,4-Difluor steht (Verbindungen I.g.10). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.g.10, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.g.10, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

35 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.g, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Fluor-4-chlor steht (Verbindungen I.g.11). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.g.11, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.g.11, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.g, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Chlor-4-fluor steht (Verbindungen I.g.12). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.g.12, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.g.12, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.g, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Methyl steht (Verbindungen I.g.13). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.g.13, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.g.13, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.g, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,4-Dimethyl steht (Verbindungen I.g.14). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.g.14, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.g.14, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.g, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Fluor-4-methyl steht (Verbindungen I.g.15). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.g.15, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.g.15, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.g, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,6-Dimethyl steht (Verbindungen I.g.16). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.g.16, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils

die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.g.16, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

10 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind die Verbindungen der allgemeinen Formel I.k, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Fluor-6-Chlor steht (Verbindungen I.k.1). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.k.1 worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.k.1, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

15
20 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.k, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,6-Difluor steht (Verbindungen I.k.2). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.k.2, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.k.2, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

25
30 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.k, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,6-Dichlor steht (Verbindungen I.k.3). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.k.3, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.k.3, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

35
40 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.k, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Fluor-6-methyl steht (Verbindungen I.k.4). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.k.4, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.k.4, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemein-

sam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

5 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.k, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,4,6-Trifluor steht (Verbindungen I.k.5). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.k.5, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.k.5, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

15 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.k, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,6-Difluor-4-methoxy steht (Verbindungen I.k.6). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.k.6, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.k.6, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

25 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.k, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Methyl-4-fluor steht (Verbindungen I.k.7). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.k.7, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.k.7, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

35 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.k, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Fluor steht (Verbindungen I.k.8). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.k.8, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.k.8, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

22

5 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.k, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Chlor steht (Verbindungen I.k.9). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.k.9, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.k.9, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

10 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.k, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,4-Difluor steht (Verbindungen I.k.10). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.k.10, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.k.10, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

20 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.k, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Fluor-4-chlor steht (Verbindungen I.k.11). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.k.11, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.k.11, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

30 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.k, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Chlor-4-fluor steht (Verbindungen I.k.12). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.k.12, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.k.12, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

40 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.k, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Methyl steht (Verbindungen I.k.13). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.k.13, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in

23

einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.k.13, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.k, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,4-Dimethyl steht (Verbindungen I.k.14). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.k.14, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.k.14, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.k, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2-Fluor-4-methyl steht (Verbindungen I.k.15). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.k.15, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.k.15, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin die Verbindungen der allgemeinen Formel I.k, worin R^2 für Chlor oder Methyl steht und $(R^a)_n$ für 2,6-Dimethyl steht (Verbindungen I.k.16). Beispiele hierfür sind Verbindungen I.k.16, worin R^2 Chlor bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist. Beispiele hierfür sind auch Verbindungen I.k.16, worin R^2 Methyl bedeutet, R^1 für NR^7R^8 steht, wobei R^7 , R^8 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen, oder R^1 die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Tabelle A:

Nr.	R^7	R^7
A-1	H	H
A-2	CH_2CH_3	H
A-3	CH_2CH_3	CH_3

Nr.	R ⁷	R ⁷
A-4	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-5	CH ₂ CF ₃	H
A-6	CH ₂ CF ₃	CH ₃
A-7	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-8	CH ₂ CCl ₃	H
A-9	CH ₂ CCl ₃	CH ₃
A-10	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-11	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-12	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-13	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-14	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-15	CH(CH ₃) ₂	H
A-16	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-17	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-18	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-19	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-20	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-21	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-22	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-23	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-24	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-25	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-26	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-27	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-28	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-29	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-30	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-31	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-32	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-33	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H

25

Nr.	R ⁷	R ⁷
A-34	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-35	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-36	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-37	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-38	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-39	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-40	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-41	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-42	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-43	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-44	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-45	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-46	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-47	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-48	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-49	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-50	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-51	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-52	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-53	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-54	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-55	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-56	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-57	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-58	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-59	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-60	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-61	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-62	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-63	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H

M/43373

26

Nr.	R ⁷	R ⁷
A-64	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₃
A-65	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-66	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	H
A-67	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₃
A-68	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-69	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-70	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-71	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-72	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-73	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-74	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-75	CH(CH ₃)CH=CH ₂	H
A-76	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₃
A-77	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-78	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	H
A-79	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-80	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-81	Cyclopentyl	H
A-82	Cyclopentyl	CH ₃
A-83	Cyclopentyl	CH ₂ CH ₃
A-84	Cyclohexyl	H
A-85	Cyclohexyl	CH ₃
A-86	Cyclohexyl	CH ₂ CH ₃
A-87	-(CH ₂) ₂ CH=CHCH ₂ -	
A-88	-(CH ₂) ₂ C(CH ₃)=CHCH ₂ -	
A-89	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-90	-(CH ₂) ₂ CHF(CH ₂) ₂ -	
A-91	-(CH ₂) ₃ CHFCH ₂ -	
A-92	-(CH ₂) ₂ CH(CF ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-93	-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	

27

Nr.	R ⁷	R ⁷
A-94	-(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ -	
A-95	-(CH ₂) ₅ -	
A-96	-(CH ₂) ₄ -	
A-97	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -	
A-98	-CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ -	
A-99	-CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	

Tabelle B:

Nr.	R ¹
B-1	CH ₃
B-2	CH ₂ CH ₃
B-3	CH ₂ CH ₂ CH ₃
B-4	CH(CH ₃) ₂
B-5	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-6	(±) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-7	(R) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-8	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-9	(CH ₂) ₃ CH ₃
B-10	C(CH ₃) ₃
B-11	(CH ₂) ₄ CH ₃
B-12	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
B-13	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-14	(±) CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
B-15	(R) CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
B-16	(S) CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
B-17	(±) CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-18	(R) CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-19	(S) CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-20	(±) CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-21	(R) CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-22	(S) CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
B-23	(CH ₂) ₅ CH ₃
B-24	(±,±) CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-25	(±,R) CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
B-26	(±,S) CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃

28

Nr.	R ¹
B-27	(±) CH ₂ CH(CH ₃)CF ₃
B-28	(R) CH ₂ CH(CH ₃)CF ₃
B-29	(S) CH ₂ CH(CH ₃)CF ₃
B-30	(±) CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ CH ₃
B-31	(R) CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ CH ₃
B-32	(S) CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ CH ₃
B-33	(±,±) CH(CH ₃)CH(CH ₃)CF ₃
B-34	(±,R) CH(CH ₃)CH(CH ₃)CF ₃
B-35	(±,S) CH(CH ₃)CH(CH ₃)CF ₃
B-36	(±,±) CH(CH ₃)CH(CF ₃)CH ₂ CH ₃
B-37	(±,R) CH(CH ₃)CH(CF ₃)CH ₂ CH ₃
B-38	(±,S) CH(CH ₃)CH(CF ₃)CH ₂ CH ₃
B-39	CF ₃
B-40	CF ₂ CF ₃
B-41	CF ₂ CF ₂ CF ₃
B-42	c-C ₃ H ₅
B-43	(1-CH ₃)-c-C ₃ H ₄
B-44	c-C ₅ H ₉
B-45	c-C ₆ H ₁₁
B-46	(4-CH ₃)-c-C ₆ H ₁₀
B-47	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂
B-48	CH ₂ CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂
B-49	CH ₂ -C(CH ₃) ₃
B-50	CH ₂ -Si(CH ₃) ₃
B-51	n-C ₆ H ₁₃
B-52	(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃) ₂
B-53	(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-C ₂ H ₅
B-54	CH ₂ -CH(CH ₃)-n-C ₃ H ₇
B-55	CH(CH ₃)-n-C ₄ H ₉
B-56	CH ₂ -CH(C ₂ H ₅) ₂
B-57	CH(C ₂ H ₅)-n-C ₃ H ₇
B-58	CH ₂ -c-C ₅ H ₉
B-59	CH ₂ -CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂
B-60	CH(CH ₃)-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
B-61	CH(CH ₃)-CH(CH ₃)-C ₂ H ₅
B-62	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃
B-63	(CH ₂) ₂ -C(CH ₃) ₃

M/43373

29

Nr.	R ¹
B-64	$\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2\text{-C}_2\text{H}_5$
B-65	$2\text{-CH}_3\text{-C-C}_5\text{H}_8$
B-66	$3\text{-CH}_3\text{-C-C}_5\text{H}_8$
B-67	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-n-C}_3\text{H}_7$
B-68	$(\text{CH}_2)_6\text{-CH}_3$
B-69	$(\text{CH}_2)_4\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$
B-70	$(\text{CH}_2)_3\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-C}_2\text{H}_5$
B-71	$(\text{CH}_2)_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-n-C}_3\text{H}_7$
B-72	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-n-C}_4\text{H}_9$
B-73	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-n-C}_5\text{H}_{11}$
B-74	$(\text{CH}_2)_3\text{C}(\text{CH}_3)_3$
B-75	$(\text{CH}_2)_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$
B-76	$(\text{CH}_2)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
B-77	$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$
B-78	$(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}_2\text{H}_5$
B-79	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}_2\text{H}_5$
B-80	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}_2\text{H}_5$
B-81	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-n-C}_3\text{H}_7$
B-82	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-n-C}_3\text{H}_7$
B-83	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-n-C}_4\text{H}_9$
B-84	$(\text{CH}_2)_2\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$
B-85	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)\text{-n-C}_3\text{H}_7$
B-86	$\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)\text{-n-C}_4\text{H}_9$
B-87	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{CH}_3)_3$
B-88	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$
B-89	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
B-90	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
B-91	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
B-92	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
B-93	$\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
B-94	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}_2\text{H}_5$
B-95	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$
B-96	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}_2\text{H}_5$
B-97	$\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}_2\text{H}_5$
B-98	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{C}_2\text{H}_5)\text{-n-C}_3\text{H}_7$
B-99	$\text{CH}(\text{n-C}_3\text{H}_7)_2$
B-100	$\text{CH}(\text{n-C}_3\text{H}_7)\text{CH}(\text{CH}_3)_2$

Nr.	R ¹
B-101	$C(CH_3)_2C(CH_3)_3$
B-102	$C(CH_3)(C_2H_5)-CH(CH_3)_2$
B-103	$C(C_2H_5)_3$
B-104	$(3-CH_3)-c-C_6H_{10}$
B-105	$(2-CH_3)-c-C_6H_{10}$
B-106	$n-C_8H_{17}$
B-107	$CH_2C(=NO-CH_3)CH_3$
B-108	$CH_2C(=NO-C_2H_5)CH_3$
B-109	$CH_2C(=NO-n-C_3H_7)CH_3$
B-110	$CH_2C(=NO-i-C_3H_7)CH_3$
B-111	$CH(CH_3)C(=NOCH_3)CH_3$
B-112	$CH(CH_3)C(=NOC_2H_5)CH_3$
B-113	$CH(CH_3)C(=NO-n-C_3H_7)CH_3$
B-114	$CH(CH_3)C(=NO-i-C_3H_7)CH_3$
B-115	$C(=NOCH_3)C(=NOCH_3)CH_3$
B-116	$C(=NOCH_3)C(=NOC_2H_5)CH_3$
B-117	$C(=NOCH_3)C(=NO-n-C_3H_7)CH_3$
B-118	$C(=NOCH_3)C(=NO-i-C_3H_7)CH_3$
B-119	$C(=NOC_2H_5)C(=NOCH_3)CH_3$
B-120	$C(=NOC_2H_5)C(=NOC_2H_5)CH_3$
B-121	$C(=NOC_2H_5)C(=NO-n-C_3H_7)CH_3$
B-122	$C(=NOC_2H_5)C(=NO-i-C_3H_7)CH_3$
B-123	$CH_2C(=NO-CH_3)C_2H_5$
B-124	$CH_2C(=NO-C_2H_5)C_2H_5$
B-125	$CH_2C(=NO-n-C_3H_7)C_2H_5$
B-126	$CH_2C(=NO-i-C_3H_7)C_2H_5$
B-127	$CH(CH_3)C(=NOCH_3)C_2H_5$
B-128	$CH(CH_3)C(=NOC_2H_5)C_2H_5$
B-129	$CH(CH_3)C(=NO-n-C_3H_7)C_2H_5$
B-130	$CH(CH_3)C(=NO-n-C_3H_7)C_2H_5$
B-131	$C(=NOCH_3)C(=NOCH_3)C_2H_5$
B-132	$C(=NOCH_3)C(=NOC_2H_5)C_2H_5$
B-133	$C(=NOCH_3)C(=NO-n-C_3H_7)C_2H_5$
B-134	$C(=NOCH_3)C(=NO-i-C_3H_7)C_2H_5$
B-135	$C(=NOC_2H_5)C(=NOCH_3)C_2H_5$
B-136	$C(=NOC_2H_5)C(=NOC_2H_5)C_2H_5$
B-137	$C(=NOC_2H_5)C(=NO-n-C_3H_7)C_2H_5$

Nr.	R ¹
B-138	$C(=NOC_2H_5)C(=NO-i-C_3H_7)C_2H_5$
B-139	$CH=CH-CH_2CH_3$
B-140	$CH_2-CH=CH-CH_3$
B-141	$CH_2-CH_2-CH=CH_2$
B-142	$C(CH_3)_2CH_2CH_3$
B-143	$CH=C(CH_3)_2$
B-144	$C(=CH_2)-CH_2CH_3$
B-145	$C(CH_3)=CH-CH_3$
B-146	$CH(CH_3)CH=CH_2$
B-147	$CH=CH-n-C_3H_7$
B-148	$CH_2-CH=CH-C_2H_5$
B-149	$(CH_2)_2-CH=CH-CH_3$
B-150	$(CH_2)_3-CH=CH_2$
B-151	$CH=CH-CH(CH_3)_2$
B-152	$CH_2-CH=C(CH_3)_2$
B-153	$(CH_2)_2-C(CH_3)=CH_2$
B-154	$CH=C(CH_3)-C_2H_5$
B-155	$CH_2-C(=CH_2)-C_2H_5$
B-156	$CH_2-C(CH_3)=CH-CH_3$
B-157	$CH_2-CH(CH_3)-CH=CH_2$
B-158	$C(=CH_2)-CH_2-CH_2-CH_3$
B-159	$C(CH_3)=CH-CH_2-CH_3$
B-160	$CH(CH_3)-CH=CH-CH_3$
B-161	$CH(CH_3)-CH_2-CH=CH_2$
B-162	$C(=CH_2)CH(CH_3)_2$
B-163	$C(CH_3)=C(CH_3)_2$
B-164	$CH(CH_3)-C(=CH_2)-CH_3$
B-165	$C(CH_3)_2-CH=CH_2$
B-166	$C(C_2H_5)=CH-CH_3$
B-167	$CH(C_2H_5)-CH=CH_2$
B-168	$CH=CH-CH_2-CH_2-CH_2-CH_3$
B-169	$CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-CH_3$
B-170	$CH_2-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_3$
B-171	$CH_2-CH_2-CH_2-CH=CH-CH_3$
B-172	$CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH=CH_2$
B-173	$CH=CH-CH_2-CH(CH_3)CH_3$
B-174	$CH_2-CH=CH-CH(CH_3)CH_3$

Nr.	R ¹
B-175	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH=C(CH}_3\text{)CH}_3$
B-176	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-C(CH}_3\text{)=CH}_2$
B-177	$\text{CH=CH-CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-178	$\text{CH}_2\text{-CH=C(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-179	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-C(=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-180	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-C(CH}_3\text{)=CH-CH}_3$
B-181	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-CH=CH}_2$
B-182	$\text{CH=C(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-183	$\text{CH}_2\text{-C(=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-184	$\text{CH}_2\text{-C(CH}_3\text{)=CH-CH}_2\text{-CH}_3$
B-185	$\text{CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-CH=CH-CH}_3$
B-186	$\text{CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH=CH}_2$
B-187	$\text{C(=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-188	$\text{C(CH}_3\text{)=CH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-189	$\text{CH(CH}_3\text{)-CH=CH-CH}_2\text{-CH}_3$
B-190	$\text{CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH=CH-CH}_3$
B-191	$\text{CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH}_2$
B-192	$\text{CH=CH-C(CH}_3\text{)}_3$
B-193	$\text{CH=C(CH}_3\text{)-CH(CH}_3\text{)-CH}_3$
B-194	$\text{CH}_2\text{-C(=CH}_2\text{)-CH(CH}_3\text{)-CH}_3$
B-195	$\text{CH}_2\text{-C(CH}_3\text{)=C(CH}_3\text{)-CH}_3$
B-196	$\text{CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-C(=CH}_2\text{)-CH}_3$
B-197	$\text{C(=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-CH}_3$
B-198	$\text{C(CH}_3\text{)=CH-CH(CH}_3\text{)-CH}_3$
B-199	$\text{CH(CH}_3\text{)-CH=C(CH}_3\text{)-CH}_3$
B-200	$\text{CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-C(=CH}_2\text{)-CH}_3$
B-201	$\text{CH=C(CH}_2\text{-CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-202	$\text{CH}_2\text{-C(=CH-CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-203	$\text{CH}_2\text{-CH(CH=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-204	$\text{C(=CH-CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-205	$\text{CH(CH=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-206	$\text{C(CH}_2\text{-CH}_3\text{)=CH-CH}_2\text{-CH}_3$
B-207	$\text{CH(CH}_2\text{-CH}_3\text{)-CH=CH-CH}_3$
B-208	$\text{CH(CH}_2\text{-CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH=CH}_2$
B-209	$\text{CH}_2\text{-C(CH}_3\text{)}_2\text{-CH=CH}_2$
B-210	$\text{C(=CH}_2\text{)-CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-211	$\text{C(CH}_3\text{)=C(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$

Nr.	R ¹
B-212	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-C(=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-213	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-C(CH}_3\text{)=CH-CH}_3$
B-214	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH(CH}_3\text{)-CH=CH}_2$
B-215	$\text{C(CH}_3\text{)}_2\text{-CH=CH-CH}_3$
B-216	$\text{C(CH}_3\text{)}_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH}_2$
B-217	$\text{C(=CH}_2\text{)-C(CH}_3\text{)}_3$
B-218	$\text{C(=CH-CH}_3\text{)-CH(CH}_3\text{)-CH}_3$
B-219	$\text{CH(CH=CH}_2\text{)-CH(CH}_3\text{)-CH}_3$
B-220	$\text{C(CH}_2\text{-CH}_3\text{)=C(CH}_3\text{)-CH}_3$
B-221	$\text{CH(CH}_2\text{-CH}_3\text{)-C(=CH}_2\text{)-CH}_3$
B-222	$\text{C(CH}_3\text{)}_2\text{-C(=CH}_2\text{)-CH}_3$
B-223	$\text{C(CH}_3\text{)(CH=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-224	$\text{C(CH}_3\text{)(CH}_2\text{CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-225	$\text{CH(CH}_2\text{CH}_3\text{)-CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-226	$\text{CH(CH}_2\text{CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-CH}_3$
B-227	$\text{C(CH}_3\text{)}_2\text{-C(CH}_3\text{)}_3$
B-228	$\text{C(CH}_2\text{-CH}_3\text{)-C(CH}_3\text{)}_3$
B-229	$\text{C(CH}_3\text{)(CH}_2\text{-CH}_3\text{)-CH(CH}_3\text{)}_2$
B-230	$\text{CH(CH(CH}_3\text{)}_2\text{)-CH(CH}_3\text{)}_2$
B-231	$\text{CH=CH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-232	$\text{CH}_2\text{-CH=CH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-233	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-234	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH-CH}_2\text{-CH}_3$
B-235	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH-CH}_3$
B-236	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH}_2$
B-237	$\text{CH=CH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-CH}_3$
B-238	$\text{CH}_2\text{-CH=CH-CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-CH}_3$
B-239	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH-CH(CH}_3\text{)-CH}_3$
B-240	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH=C(CH}_3\text{)-CH}_3$
B-241	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-C(=CH}_2\text{)-CH}_3$
B-242	$\text{CH=CH-CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-243	$\text{CH}_2\text{-CH=CH-CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-244	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH=C(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-245	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-C(=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-246	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-C(CH}_3\text{)=CH-CH}_3$
B-247	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-CH=CH}_2$
B-248	$\text{CH=CH-CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$

Nr.	R ¹
B-249	$\text{CH}_2\text{-CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-250	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-251	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{CH-CH}_2\text{-CH}_3$
B-252	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}=\text{CH-CH}_3$
B-253	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}=\text{CH}_2$
B-254	$\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-255	$\text{CH}_2\text{-C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-256	$\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{CH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-257	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}=\text{CH-CH}_2\text{-CH}_3$
B-258	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}=\text{CH-CH}_3$
B-259	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}=\text{CH}_2$
B-260	$\text{C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-261	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-262	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}=\text{CH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-263	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}=\text{CH-CH}_2\text{-CH}_3$
B-264	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}=\text{CH-CH}_3$
B-265	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}=\text{CH}_2$
B-266	$\text{CH}=\text{CH-CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_3$
B-267	$\text{CH}_2\text{-CH}=\text{CH-C}(\text{CH}_3)_3$
B-268	$\text{CH}=\text{CH-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$
B-269	$\text{CH}_2\text{-CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$
B-270	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$
B-271	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
B-272	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_3$
B-273	$\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$
B-274	$\text{CH}_2\text{-C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$
B-275	$\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{CH-CH}(\text{CH}_3)_2$
B-276	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
B-277	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_3$
B-278	$\text{C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$
B-279	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$
B-280	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}=\text{CH-CH}(\text{CH}_3)_2$
B-281	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
B-282	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_3$
B-283	$\text{CH}=\text{CH-C}(\text{CH}_3)_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-284	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2\text{-CH}=\text{CH}_2$
B-285	$\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$

Nr.	R ¹
B-286	$\text{CH}_2\text{-C(=CH}_2\text{)-CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-287	$\text{CH}_2\text{-C(CH}_3\text{)=C(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-288	$\text{CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-C(=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-289	$\text{CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-C(CH}_3\text{)=CH-CH}_3$
B-290	$\text{CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-CH(CH}_3\text{)-CH=CH}_2$
B-291	$\text{C(=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-292	$\text{C(CH}_3\text{)=CH-CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-293	$\text{CH(CH}_3\text{)-CH=C(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-294	$\text{CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-C(=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-295	$\text{CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-C(CH}_3\text{)=CH-CH}_3$
B-296	$\text{CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH(CH}_3\text{)-CH=CH}_2$
B-297	$\text{CH}_2\text{-C(CH}_3\text{)}_2\text{-CH=CH-CH}_3$
B-298	$\text{CH}_2\text{-C(CH}_3\text{)}_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH}_2$
B-299	$\text{C(=CH}_2\text{)-CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-300	$\text{C(CH}_3\text{)=C(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-301	$\text{CH(CH}_3\text{)-C(=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-302	$\text{CH(CH}_3\text{)-C(CH}_3\text{)=CH-CH}_2\text{-CH}_3$
B-303	$\text{CH(CH}_3\text{)-CH(CH}_3\text{)-CH=CH-CH}_3$
B-304	$\text{CH(CH}_3\text{)-CH(CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH=CH}_2$
B-305	$\text{C(CH}_3\text{)}_2\text{-CH=CH-CH}_2\text{-CH}_3$
B-306	$\text{C(CH}_3\text{)}_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH-CH}_3$
B-307	$\text{C(CH}_3\text{)}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH}_2$
B-308	$\text{CH=CH-CH(CH}_2\text{-CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-309	$\text{CH}_2\text{-CH=C(CH}_2\text{-CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-310	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-C(=CH-CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-311	$\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH(CH=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_3$
B-312	$\text{CH=C(CH}_2\text{-CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-313	$\text{CH}_2\text{-C(=CH-CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-314	$\text{CH}_2\text{-CH(CH=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-315	$\text{CH}_2\text{-C(CH}_2\text{-CH}_3\text{)=CH-CH}_2\text{-CH}_3$
B-316	$\text{CH}_2\text{-CH(CH}_2\text{-CH}_3\text{)-CH=CH-CH}_3$
B-317	$\text{CH}_2\text{-CH(CH}_2\text{-CH}_3\text{)-CH-CH=CH}_2$
B-318	$\text{C(=CH-CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-319	$\text{CH(CH=CH}_2\text{)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-320	$\text{C(CH}_2\text{-CH}_3\text{)=CH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-321	$\text{CH(CH}_2\text{-CH}_3\text{)-CH=CH-CH}_2\text{-CH}_3$
B-322	$\text{CH(CH}_2\text{-CH}_3\text{)-CH}_2\text{-CH=CH-CH}_3$

Nr.	R ¹
B-323	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH=CH}_2$
B-324	$\text{C}(=\text{CH-CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-325	$\text{C}(\text{CH=CH-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-326	$\text{C}(\text{CH}_2\text{-CH=CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-327	$\text{CH=C}(\text{CH}_3)\text{-C}(\text{CH}_3)_3$
B-328	$\text{CH}_2\text{-C}(=\text{CH}_2)\text{-C}(\text{CH}_3)_3$
B-329	$\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2\text{-CH(=CH}_2)\text{-CH}_3$
B-330	$\text{C}(=\text{CH}_2)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
B-331	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
B-332	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-C}(=\text{CH}_2)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
B-333	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
B-334	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-C}(=\text{CH}_2)\text{-CH}_3$
B-335	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-CH=C}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
B-336	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-CH}_2\text{-C}(=\text{CH}_2)\text{-CH}_3$
B-337	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-C}(=\text{CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-338	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{CH-CH}_3$
B-339	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{CH=CH}_2$
B-340	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
B-341	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-342	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-343	$\text{CH}(\text{i-C}_3\text{H}_7)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-344	$\text{CH=C}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
B-345	$\text{CH}_2\text{-C}(=\text{CH-CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
B-346	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH=CH}_2)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
B-347	$\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
B-348	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-C}(=\text{CH}_2)\text{-CH}_3$
B-349	$\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)(\text{CH=CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-350	$\text{C}(=\text{CH}_2)\text{-CH}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-351	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-352	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-C}(=\text{CH-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-353	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH=CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-354	$\text{CH=C}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
B-355	$\text{CH}_2\text{-C}(=\text{CH-CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
B-356	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH=CH}_2)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
B-357	$\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
B-358	$\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-C}(=\text{CH}_2)\text{-CH}_3$
B-359	$\text{C}(=\text{CH-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$

37

Nr.	R ¹
B-360	$\text{CH}(\text{CH}=\text{CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
B-361	$\text{C}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)=\text{CH-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
B-362	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
B-363	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{CH}_2\text{-C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_3$
B-364	$\text{C}(\text{=CH-CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-365	$\text{CH}(\text{CH}=\text{CH}_2)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-366	$\text{C}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-367	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-368	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{CH-CH}_3$
B-369	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}=\text{CH}_2$
B-370	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}=\text{CH}_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-371	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}=\text{CH-CH}_3$
B-372	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}=\text{CH}_2$
B-373	$\text{C}[\text{C}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3]\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-374	$\text{CH}[\text{C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_3]\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_3$
B-375	$\text{C}(\text{i-C}_3\text{H}_7)=\text{CH-CH}_2\text{-CH}_3$
B-376	$\text{CH}(\text{i-C}_3\text{H}_7)\text{-CH}=\text{CH-CH}_3$
B-377	$\text{CH}(\text{i-C}_3\text{H}_7)\text{-CH}_2\text{-CH}=\text{CH}_2$
B-378	$\text{C}(\text{=CH-CH}_3)\text{-C}(\text{CH}_3)_3$
B-379	$\text{CH}(\text{CH}=\text{CH}_2)\text{-C}(\text{CH}_3)_3$
B-380	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}=\text{CH}_2)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_3$
B-381	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{-CH}_3)\text{C}(\text{=CH}_2)\text{-CH}_3$
B-382	2-CH ₃ -Cyclohex-1-enyl
B-383	[2-(=CH ₂)]-c-C ₆ H ₉
B-384	2-CH ₃ -Cyclohex-2-enyl
B-385	2-CH ₃ -Cyclohex-3-enyl
B-386	2-CH ₃ -Cyclohex-4-enyl
B-387	2-CH ₃ -Cyclohex-5-enyl
B-388	2-CH ₃ -Cyclohex-6-enyl
B-389	3-CH ₃ -Cyclohex-1-enyl
B-390	3-CH ₃ -Cyclohex-2-enyl
B-391	[3-(=CH ₂)]-c-C ₆ H ₉
B-392	3-CH ₃ -Cyclohex-3-enyl
B-393	3-CH ₃ -Cyclohex-4-enyl
B-394	3-CH ₃ -Cyclohex-5-enyl
B-395	3-CH ₃ -Cyclohex-6-enyl
B-396	4-CH ₃ -Cyclohex-1-enyl

M/43373

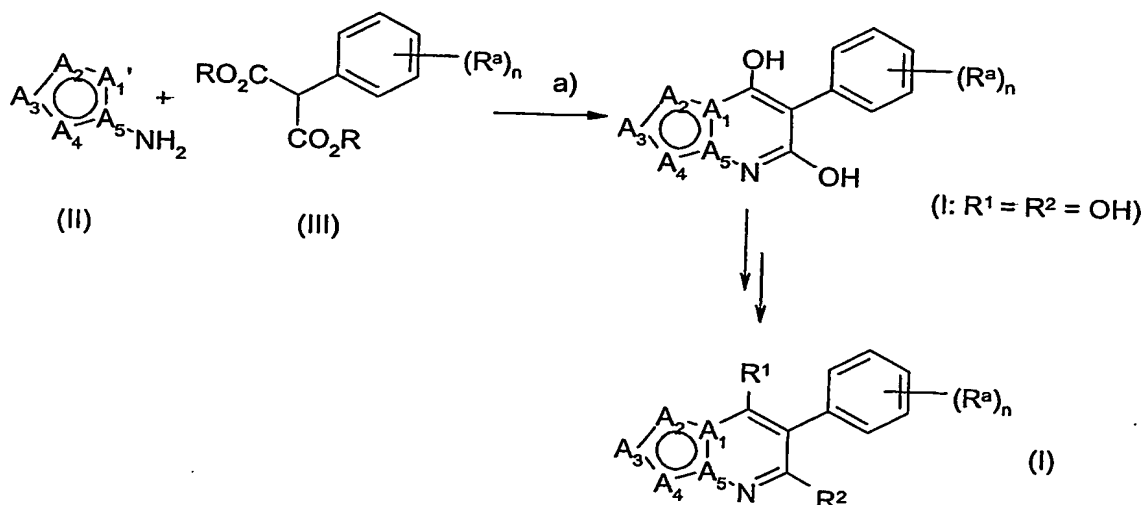
38

Nr.	R ¹
B-397	4-CH ₃ -Cyclohex-2-enyl
B-398	4-CH ₃ -Cyclohex-3-enyl
B-399	[4-(=CH ₂)]-c-C ₆ H ₉

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I können in Analogie zu an sich bekannten Methoden des Standes der Technik nach den in den folgenden Schemata dargestellten Synthesen hergestellt werden:

5

Schema 1:



10 In Schema 1 haben n, R^a, R¹, R² und A₁ bis A₅ die zuvor genannten Bedeutungen. In Formel II steht A₁' für N, NH oder C-R^{3a}. In Formel II sind für A₅ = N die Variablen A₁' mit A₂ und A₃ mit A₄ und für A₅ = C die Variablen A₅ mit A₁' und A₃ mit A₄ oder alternativ A₄ mit A₅ und A₃ mit A₂ jeweils durch eine Doppelbindung verbunden. R steht für C₁-C₄-Alkyl, insbesondere für Methyl oder Ethyl.

15 Gemäß Schema 1 wird in einem ersten Schritt ein Hetarylamin der allgemeinen Formel II mit einem geeignet substituierten 2-Phenylmalonsäuredialkylester III kondensiert. Beispiele für geeignete Hetarylamine der allgemeinen Formel II sind 2-Aminopyrrol, 1-Aminopyrazol, 1-Amino-1,2,4-triazol, 1-Amino-1,3,4-triazol, 5-Amino-1,2,3-triazol, 4-Aminothiazol, 5-Aminothiazol, 4-Aminoisothiazol, 5-Aminoisothiazol, 4-Aminothia-2,3-diazol, 5-Aminothia-2,3-diazol, 5-Amino-1,2,3,4-tetrazol, 1-Alkyl-5-aminoimidazol, 1-Alkyl-4-aminoimidazol und 2-Aminoimidazol. So erhält man bei Einsatz von:

- 25
- 1-Aminopyrazol die Verbindungen I.a mit R¹ = R² = OH,
 - 1-Amino-1,2,4-triazol die Verbindungen I.b mit R¹ = R² = OH,
 - 1-Amino-1,3,4-triazol die Verbindungen I.c mit R¹ = R² = OH,

- 2-Aminopyrrol die Verbindungen I.e mit $R^1 = R^2 = OH$,
- 5-Aminoimidazol die Verbindungen I.f mit $R^1 = R^2 = OH$,
- 4-Amino-1,2,3-triazol die Verbindungen I.h mit $R^1 = R^2 = OH$,
- 5-Amino-1,2,3,4-tetrazol die Verbindungen I.k mit $R^1 = R^2 = OH$,
- 5 - 5-Aminoisothiazol die Verbindungen I.m mit $R^1 = R^2 = OH$,
- 5-Aminothiazol die Verbindungen I.n mit $R^1 = R^2 = OH$,
- 5-Aminothia-2,3-diazol die Verbindungen I.o mit $R^1 = R^2 = OH$,
- 4-Aminoisothiazol die Verbindungen I.p mit $R^1 = R^2 = OH$,
- 4-Aminothiazol die Verbindungen I.q mit $R^1 = R^2 = OH$,
- 10 - 4-Aminothia-2,3-diazol die Verbindungen I.r mit $R^1 = R^2 = OH$,
- 2-Aminothiophen die Verbindungen I.s mit $R^1 = R^2 = OH$,
- 3-Aminothiophen die Verbindungen I.t mit $R^1 = R^2 = OH$,
- 1-Alkyl-5-aminoimidazol die Verbindungen I.u mit $R^1 = R^2 = OH$,
- 1-Alkyl-4-aminoimidazol die Verbindungen I.v mit $R^1 = R^2 = OH$;

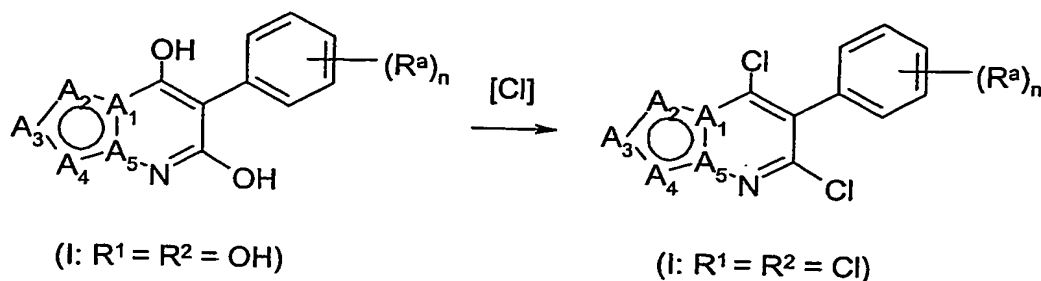
15 Die Kondensationsreaktion erfolgt in der Regel in Gegenwart einer Brönstedt- oder Lewissäure als saurem Katalysator oder in Gegenwart eines basischen Katalysators. Beispiele für geeignete saure Katalysatoren sind Zinkchlorid, Phosphorsäure, Salzsäure, Essigsäure, sowie Mischungen aus Salzsäure und Zinkchlorid. Beispiele für basische Katalysatoren sind tertiäre Amine, wie Triethylamin, Tri-n-butylamin, Pyridinbasen wie Pyridin und Chinolin, und Amidinbasen wie DBN oder DBU.

25 Sauer katalysierte Kondensationsreaktionen dieses Typs sind aus der Literatur prinzipiell bekannt, z.B. aus G. Saint-Ruf et al., J. Heterocycl. Chem. 1981, 18, S. 1565-1570; I. Adachi et al., Chem. and Pharm. Bull. 1987, 35, S. 3235-3252; B. M. Lynch et al., Can. J. Chem. 1988, 66, S. 420-428; Y. Blache et al., Heterocycles, 1994, 38, S. 1527-1532; V.D. Piaz et al., Heterocycles 1985, 23, S. 2639-2644; A. Elbannany et al., Pharmazie 1988, 43, S. 128-129; D. Brugier et al., Tetrahedron 2000, S. 56, 2985-2933; K. C. Joshi et al., J. Heterocycl. Chem. 1979, 16, S. 1141-1145. Die dort beschriebenen Methoden können in analoger Weise zur Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen I ($R^1 = R^2 = OH$) genutzt werden.

30 Basisch katalysierte Kondensationsreaktionen dieses Typs sind aus der Literatur prinzipiell bekannt, z.B. aus EP-A 770615. Die dort angegebene Methode kann in analoger Weise zur Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen I ($R^1 = R^2 = OH$) genutzt werden.

40 Bei der in Schema 1 gezeigten Kondensation erhält man Azoloverbindungen der allgemeinen Formel I worin R^1 und R^2 gleichzeitig für OH stehen. Derartige Azoloverbindungen I ($R^1 = R^2 = OH$), sind als Zwischenprodukte für die Herstellung anderer Azoloverbindungen I von besonderem Interesse. Die OH-Gruppen in diesen Verbindungen können in einem oder mehreren Schritten in andere funktionelle Gruppen umgewandelt werden. In der Regel wird man hierzu zunächst die OH-Gruppen in Halogenatome, insbesondere in Chloratome überführen (siehe Schema 1a).

Schema 1a:



5

Diese Umwandlung gelingt beispielsweise durch Umsetzung von I $\{R^1 = R^2 = OH\}$ mit einem geeigneten Halogenierungsmittel (in Schema 1a für ein Chlorierungsmittel $[Cl]$ gezeigt). Als Halogenierungsmittel eignen sich beispielsweise Phosphortribromid, Phosphorylchlorid, und insbesondere Chlorierungsmittel wie $POCl_3$, PCl_3/Cl_2 oder PCl_5 , und Mischungen dieser Reagenzien. Die Reaktion kann in überschüssigem Halogenierungsmittel ($POCl_3$) oder einem inerten Lösungsmittel, wie beispielsweise Acetonitril oder 1,2-Dichlorethan durchgeführt werden. Für die Chlorierung ist die Umsetzung von I $\{R^1 = R^2 = OH\}$ in $POCl_3$ bevorzugt.

10

15

Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise zwischen 10 und 180°C. Aus praktischen Gründen entspricht gewöhnlich die Reaktionstemperatur der Siedetemperatur des eingesetzten Chlorierungsmittels ($POCl_3$) oder des Lösungsmittels. Das Verfahren wird vorteilhaft unter Zusatz von N,N-Dimethylformamid oder von Stickstoffbasen, wie beispielsweise N,N-Dimethylanilin in katalytischen oder stöchiometrischen Mengen durchgeführt.

20

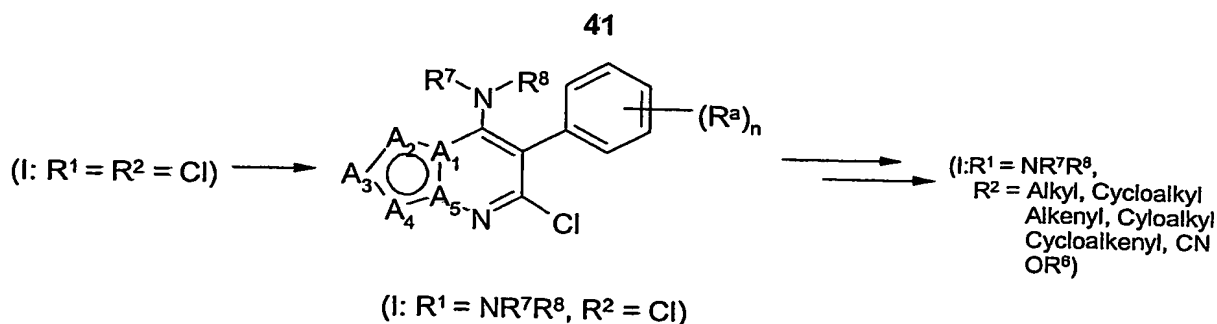
25

Die hierbei erhaltenen Dihalogenverbindungen I, z.B. die Dichlorverbindungen I $\{R^1 = R^2 = Cl\}$, können dann in Analogie zu den im eingangs zitierten Stand der Technik in andere Verbindungen I umgewandelt werden. Azoloverbindungen der allgemeinen Formel I worin R^1 und R^2 gleichzeitig für Halogen stehen, sind daher als Zwischenprodukte für die Herstellung anderer Azoloverbindungen I von besonderem Interesse. Einen Überblick über derartige Umwandlungen geben die Schemata 1b und 1c.

30

So kann man beispielsweise, wie in Schema 1b gezeigt, die Dichlorverbindungen I $\{R^1 = R^2 = Cl\}$ mit einem Amin HNR^7R^8 umsetzen, wobei man eine Verbindung I erhält, worin R^1 für NR^7R^8 steht und R^2 Chlor bedeutet.

Schema 1b:



Die im ersten Schritt von Schema 1b dargestellte Methode ist im Prinzip für die Herstellung von 5-Chlor-7-amino-6-aryl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidinen aus der US 5,593,996 und der WO 98/46607 bekannt und kann in analoger Weise zur Herstellung von Verbindungen I ($R^1 = \text{NR}^7\text{R}^8$, $R^2 = \text{Cl}$) angewendet werden.

Die Umsetzung der Dichlorverbindungen I ($R^1 = R^2 = \text{Cl}$) mit einem Amin HNR^7R^8 erfolgt üblicherweise bei 0 bis 150°C, vorzugsweise bei 10 bis 120°C in einem inerten Lösungsmittel gegebenenfalls in Gegenwart einer Hilfsbase. Diese Methode ist prinzipiell bekannt z.B. aus J. Chem. Res. S (7), S. 286-287 (1995) und Liebigs Ann. Chem., S. 1703-1705 (1995) sowie aus dem eingangs zitierten Stand der Technik bekannt und kann in analoger Weise zur Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen angewendet werden.

Als Lösungsmittel kommen protische Lösungsmittel, wie Alkohole, beispielsweise Ethanol, sowie aprotische Lösungsmittel, beispielsweise aromatische Kohlenwasserstoffe, Halogenkohlenwasserstoff und Ether, z.B. Toluol, o-, m- und p-Xylol, Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan Tetrahydrofuran, Dichlormethan, insbesondere tert. Butylmethylether und Tetrahydrofuran sowie Mischungen der vorgenannten Lösungsmittel, in Betracht. Geeignete Hilfsbase sind beispielsweise die im folgenden genannten: Alkalimetallcarbonate und -Hydrogencarbonate wie NaHCO_3 , und Na_2CO_3 , Alkalimetallhydrogenphosphate wie Na_2HPO_4 , Alkalimetallborate wie $\text{Na}_2\text{B}_4\text{O}_7$, tertiäre Amine und Pyridinverbindungen Diethylanilin und Ethyldiisopropylamin. Als Hilfsbase kommt auch ein Überschuss desamins HNR^7R^8 in Betracht.

Üblicherweise werden die Komponenten in etwa stöchiometrischem Verhältnis eingesetzt. Es kann jedoch vorteilhaft sein, das Amin HNR^7R^8 im Überschuss einzusetzen.

Die Amine HNR^7R^8 sind käuflich oder literaturbekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden.

In den auf diesem Wege erhaltene Verbindung I ($R^1 = \text{NR}^7\text{R}^8$, $R^2 = \text{Cl}$) kann das Chloratom in an sich bekannter Weise in andere Substituenten R^2 umgewandelt werden.

Verbindungen der Formel I, worin R^2 für OR^6 steht, werden aus den entsprechenden Chlorverbindungen der Formel I ($R^1 = \text{NR}^7\text{R}^8$, $R^2 = \text{Cl}$) durch Umsetzung mit Alkalimetallhydroxiden ($\text{OR}^6 = \text{OH}$), Alkali- oder Erdalkalimetallalkoholaten ($\text{OR}^6 = \text{O-Alkyl}$, O-M/43373

5 Haloalkyl} erhalten [vgl.: Heterocycles, Bd. 32, S. 1327-1340 (1991); J. Heterocycl. Chem. Bd. 19, S. 1565-1567 (1982); Geterotsikl. Soedin, S. 400-402 (1991)]. Veresterung von Verbindungen mit $R^2 = OH$ nach an sich bekannten Methoden liefert Verbindungen I, worin R^2 für $O-C(O)R^9$ steht. Verbindungen mit $R^2 = OH$ können nach an sich bekannten Methoden der Veretherung in die entsprechenden Verbindungen I überführt werden, worin R^2 für O-Alkyl, O-Haloalkyl oder O-Alkenyl steht.

10 Verbindungen der Formel I, in der R^2 für Cyano steht, können aus den entsprechenden Chlorverbindungen der Formel I $\{R^1 = NR^7R^8, R^2 = Cl\}$ durch Umsetzung mit Alkali-, Erdalkalimetall- oder Metallcyaniden, wie NaCN, KCN oder $Zn(CN)_2$, erhalten werden [vgl.: Heterocycles, Bd. 39, S. 345-356 (1994); Collect. Czech. Chem. Commun. Bd. 60, S. 1386-1389 (1995); Acta Chim. Scand., Bd. 50, S. 58-63 (1996)].

15 Die Umwandlung von Chlorverbindungen der Formel I $\{R^1 = NR^7R^8, R^2 = Cl\}$ in Verbindungen der Formel I, worin R^2 für C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Haloalkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl, C_5-C_8 -Cycloalkenyl steht gelingt in an sich bekannter Weise durch Umsetzung mit metallorganischen Verbindungen R^{2a} -Met, worin R^{2a} für C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Haloalkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl, C_5-C_8 -Cycloalkenyl steht und Met Lithium, Magnesium oder Zink bedeutet. Die Umsetzung
20 vorzugsweise in Gegenwart katalytischer oder insbesondere wenigstens äquimolarer Mengen an Übergangsmetallsalzen und/oder -verbindungen, insbesondere in Gegenwart von Cu-Salzen wie Cu(I)halogenide und speziell Cu(I)iodid. In der Regel erfolgt die Umsetzung in einem inerten organischen Lösungsmittel, beispielsweise einem der vorgenannten Ether, insbesondere Tetrahydrofuran, einem aliphatischen oder cycloaliphatischen Kohlenwasserstoff wie Hexan, Cyclohexan und dergleichen, einem aromatischen Kohlenwasserstoff wie Toluol oder in einer Mischung dieser Lösungsmittel. Die hierfür erforderlichen Temperaturen liegen im Bereich von -100 bis $+100^\circ C$ und speziell im Bereich von $-80^\circ C$ bis $+40^\circ C$.

30 Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin R^1 für NR^7R^8 und R^2 für Methyl stehen, können außerdem aus den Chlorverbindungen der Formel I $\{R^1 = NR^7R^8, R^2 = Cl\}$ hergestellt werden, indem man diese mit einem Dialkylmalonat in Gegenwart einer Base oder mit dem Alkalimetallsalz eines Dialkylmalonats umsetzt und anschließend eine saure Hydrolyse durchführt. Das Verfahren ist grundsätzlich aus der US 5,994,360
35 bekannt und kann in analoger Weise für die Herstellung von Verbindungen I, worin R^1 für NR^7R^8 und R^2 für Methyl stehen, angewendet werden.

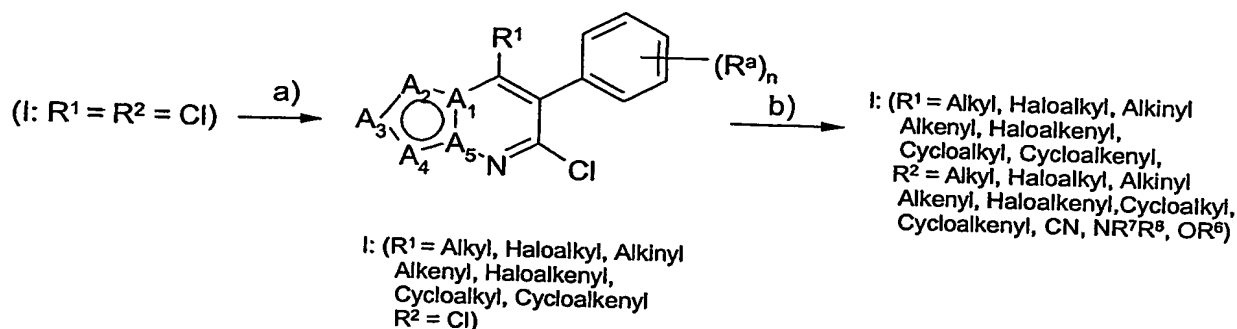
40 Durch entsprechende Abwandlung der in Schema 1b gezeigten Synthese kann man auch in einem ersten Schritt anstelle der Gruppe NR^7R^8 eine Nitrilgruppe, eine Gruppe $OR^{6'}$ $\{R^{6'} = Alkyl\}$ oder eine Gruppe $S-R^{6''}$ $\{R^{6''} = H \text{ oder } Alkyl\}$ nach den hier angegebenen Methoden als Substituent R^1 einführen.

Die Herstellung von Verbindungen der Formel I, worin R^1 für C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Haloalkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl, C_5-C_8 -Cycloalkenyl steht,

43

gelingt nach der in Schema 1c dargestellten Methode, in dem man die Dichlorverbindung I ($R^1 = R^2 = \text{Cl}$) in der oben beschriebenen Weise mit metallorganischen Verbindungen R^{2a} -Met umsetzt, worin R^{2a} für C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl oder C_5 - C_8 -Cycloalkenyl steht und Met für Lithium, Magnesium oder Zink stehen.

Schema 1c:

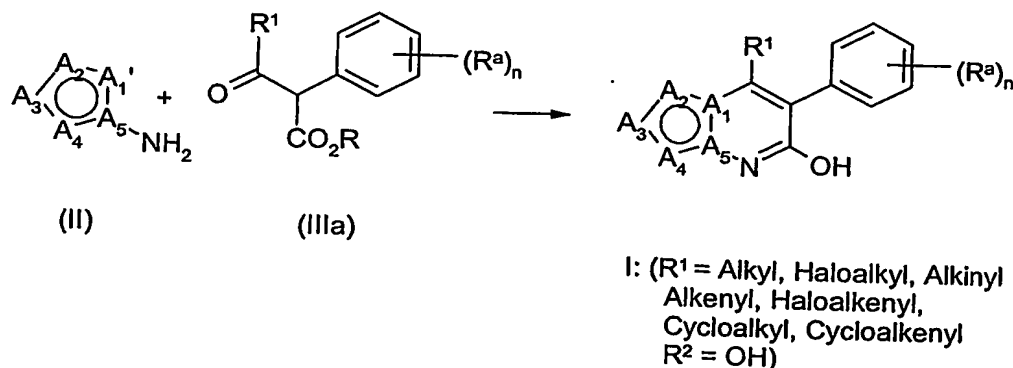


Die in Schritt a) dargestellte Umsetzung kann in Analogie zu der in WO 99/41255 beschriebenen Methode erfolgen. In den dabei erhaltenen Verbindungen kann das Chloratom (Substituent R^2) dann nach den für Schema 1b angegebenen Methoden in andere Substituenten R^2 umgewandelt werden.

Verbindungen der Formel I, worin R^1 für C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl oder C_5 - C_8 -Cycloalkenyl steht, lassen sich analog zu der in Schema 1 Schritt a) beschriebenen Synthese auch durch entsprechende Abwandlung der Ausgangsmaterialien der Formel III herstellen. Diese Verfahren sind in den Schemata 1d und 1e dargestellt.

Anstatt des Phenylmalonesters der Formel III werden gemäß Schema 1d Phenyl- β -ketoester der Formel IIIa eingesetzt, worin R^1 die vorgenannten Bedeutungen hat und R C_1 - C_4 -Alkyl, insbesondere Methyl oder Ethyl bedeutet.

Schema 1d:

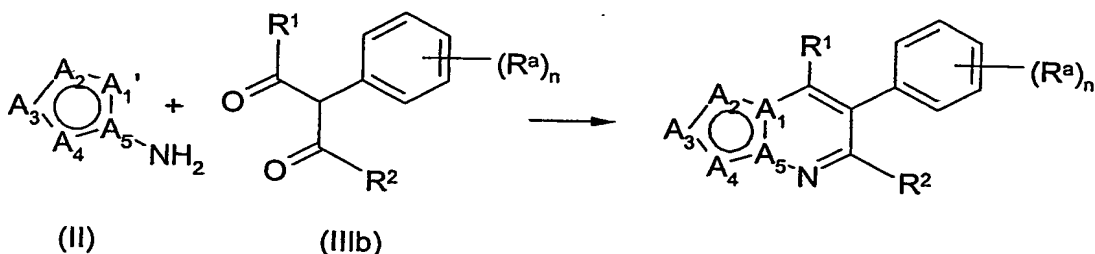


M/43373

In den dabei erhaltenen Verbindungen I kann die Hydroxygruppe (Substituent R^2) dann nach den für die Schemata 1a, 1b und 1c angegebenen Methoden in andere Substituenten R^2 umgewandelt werden.

Gemäß Schema 1e werden anstatt des Phenylmalonesters der Formel III 2-Phenyl- β -diketone der Formel IIIb eingesetzt. Hierin haben R^1 und R^2 unabhängig voneinander die folgenden Bedeutungen: C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl oder C_5 - C_8 -Cycloalkenyl.

Schema 1e:



I: (R^1 , R^2 = Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Haloalkenyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl)

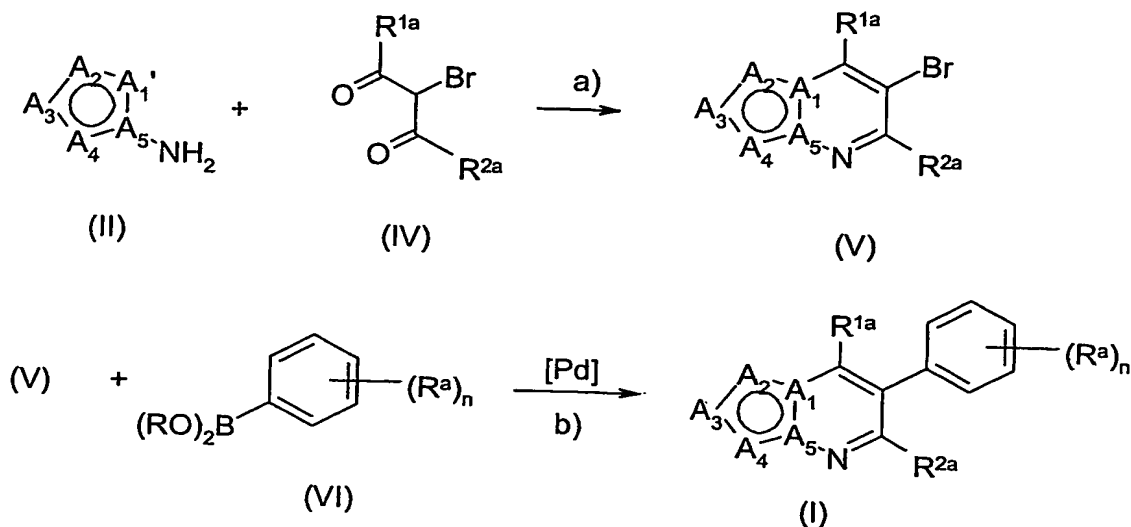
Die zur Herstellung der Verbindungen I eingesetzten Phenylmalonester der Formel III sind aus dem eingangs zitierten Stand der Technik bekannt oder können in an sich bekannter Weise durch Pd-katalysierte Kupplung von 2-Brommalonestern mit geeignet substituierten Phenylboronsäuren oder -boronsäurederivaten im Sinne einer Suzuki-Kupplung hergestellt werden (Übersicht siehe A. Suzuki et al. in Chem. Rev. 1995, 95, S. 2457-2483). In analoger Weise sind auch substituierte 2-Phenyl-3-oxocarbon-säureester IIIa und substituierte α -Phenyl- β -diketone IIIb herstellbar. α -Phenyl- β -diketone IIIb sind zudem aus der WO 02/74753 bekannt.

Hetarylamine der Formel II sind teilweise käuflich oder aus der Literatur bekannt, z.B. aus J. Het. Chem. 1970, 7, S.1159; J.Org.Chem. 1985, 50, S.5520; Synthesis 1989, 4, S.269; Tetrahedron Lett. 1995, 36, S.9261, oder können durch Reduktion der entsprechenden Nitroheteroaromaten in an sich bekannter Weise hergestellt werden.

Ein weiterer Zugang zu den erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I ist in Schema 2 dargestellt. Hierzu wird in Analogie zu der in Schema 1, Schritt a) bzw. zu der in Schema 1e dargestellten Methode ein 2-Brom-1,3-diketon der Formel IV mit einem Hetarylamin der Formel II umgesetzt.

Schema 2:

45



In Schema 2 haben n, R^a, R¹, R² und A₁ bis A₅ die zuvor genannten Bedeutungen. In Formel II steht A₁' für N, NH oder CH. In Formel II sind für A₅ = N die Variablen A₁' mit A₂ und A₃ mit A₄ und für A₅ = C die Variablen A₅ mit A₁' und A₃ mit A₄ oder alternativ A₄ mit A₅ und A₃ mit A₂ jeweils durch eine Doppelbindung verbunden. R^{1a} und R^{2a} in Formel IV stehen unabhängig voneinander für: C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Haloalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₃-C₈-Cycloalkyl oder C₅-C₈-Cycloalkenyl. In Formel VI steht (RO)₂B für einen von Borsäure abgeleiteten Rest, z.B. für (HO)₂B, (C₁-C₄-Alkyl-O)₂B oder für einen von Borsäureanhydrid abgeleiteten Rest. [Pd] steht hierbei für einen Palladium(0)komplex, der vorzugsweise 4 Trialkylphosphin- oder Triarylphosphin-Liganden aufweist.

Die Umsetzung von II mit IV erfolgt üblicherweise unter den für Schema 1 angegebenen basischen Kondensationsbedingungen. Basisch katalysierte Kondensationsreaktionen dieses Typs sind aus der Literatur prinzipiell bekannt, z.B. aus EP-A 770615. Die dort angegebene Methode kann in analoger Weise zur Herstellung der Verbindungen V genutzt werden. Die Umsetzung von II mit IV kann auch in Gegenwart einer Brönstedt- oder Lewissäure als saurem Katalysator erfolgen. Beispiele für geeignete saure Katalysatoren sind die im Zusammenhang mit Schema 1, Schritt a) genannten sauren Katalysatoren. Die dort beschriebenen Methoden können in analoger Weise zur Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen V genutzt werden (siehe auch die dort zitierte Literatur).

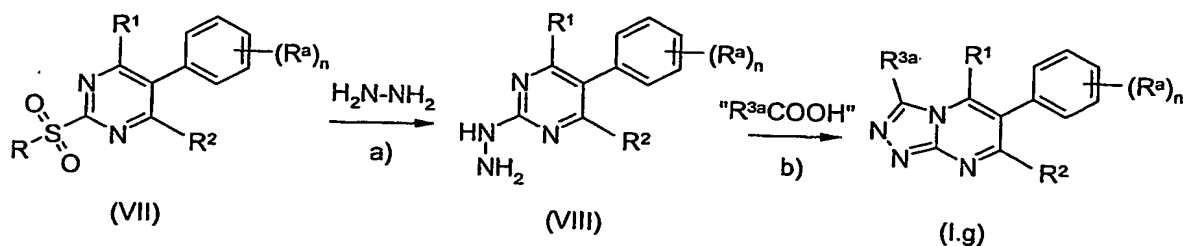
Die bei der Kondensation erhaltenen Verbindungen V werden dann mit einer Phenylboronsäureverbindung VI unter den Bedingungen einer Suzuki-Reaktion (s.o.) umgesetzt. Die hierfür erforderlichen Reaktionsbedingungen sind aus der Literatur bekannt, z.B. aus A. Suzuki et al. in Chem. Rev. 1995, 95, S. 2457-2483 sowie, J. Org. Chem. 1984, 49, S. 5237 und J. Org. Chem. 2001, 66(21) S. 7124-7128.

46

Verbindungen der allgemeinen Formel I.g, worin R^1 und R^2 unabhängig voneinander für Halogen, NR^7R^8 , C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Haloalkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl, C_5-C_8 -Cycloalkenyl bedeuten, können auch gemäß der in Schema 3 dargestellten Synthese hergestellt werden:

5

Schema 3:



- 10 In Schema 3 haben n , R^a die zuvor genannten Bedeutungen. R steht für C_1-C_4 -Alkyl oder C_1-C_4 -Haloalkyl, insbesondere für Methyl und R^1 und R^2 bedeuten unabhängig voneinander für Halogen, NR^7R^8 , C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Haloalkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl oder C_5-C_8 -Cycloalkenyl. Vorzugsweise steht R^1 in Schema 3 für NR^7R^8 , worin R^7 , R^8 die zuvor genannten Bedeutungen aufweisen. R^2 steht vorzugsweise für Halogen und insbesondere für Chlor.

15 In Schritt a) von Schema 3 wird die Pyrimidinverbindung VII in an sich bekannter Weise mit Hydrazin oder Hydrazinhydrat umgesetzt, wobei man die Verbindung der Formel VIII erhält. Derartige Umsetzungen sind aus der Literatur prinzipiell bekannt, z.B. von D.T Hurst et al, Heterocycles 1977, 6, S. 1999-2004 und können in analoger Weise zur Herstellung der Verbindungen VIII angewendet werden.

25 In Schritt b) wird dann das 2-Hydrazinopyrimidin IX mit einer Carbonsäure $R^{3a}-COOH$, insbesondere mit Ameisensäure oder einem Ameisensäureequivalent, z.B. einem Ameisensäureorthoester wie Triethylorthoformat, Bis(dimethylamino)methoxymethan, Dimethylamino(bismethoxy)methan und dergleichen cyclisiert. Die Cyclisierung kann in einer Stufe erfolgen, wie in Heterocycles 1986, 24, S. 1899-1909; J. Chem. Res. 1995, 11, S. 434f.; J. Heterocycl. Chem. 1998, 35, S. 325-327, Pharmazie 2000, 55, S. 356-358, J. Heterocycl. Chem. 1990, 27, S. 1559-1563, Org. Prep. Proc. Int. 1991, 23, S. 413-418, Liebigs Ann. Chem. 1984, S. 1653-1661, Heterocycles, 1984, 22, S. 1821 oder Chem. Ber. 1970, 103, S. 1960 beschrieben. Die Umsetzung kann aber auch in zwei Stufen durchgeführt werden, wobei man in einer ersten Stufe die Verbindung VIII mit Triethylorthoformat, Bis(dimethylamino)methoxymethan oder Dimethylamino(bismethoxy)methan bei erhöhter Temperatur in einem aprotischen Lösungsmittel, beispielsweise einem Ether wie Tetrahydrofuran oder Dimethylformamid umsetzt und anschließend die dabei erhaltene Zwischenstufe unter Säurekatalyse cyclisiert, wobei man die Verbindung I erhält. Methoden hierzu sind bekannt, z.B. aus Z. Chem. 1990, 20, 320f, Croat. Chem. Acta, 1976, 48, S161-167, Liebigs Ann. Chem. 1980, S. 1448-1453, J. Chem. Soc. Perkin. Trans. 1984, S. 993-998, J. Heterocycl. Chem. 1996, 33, M/43373

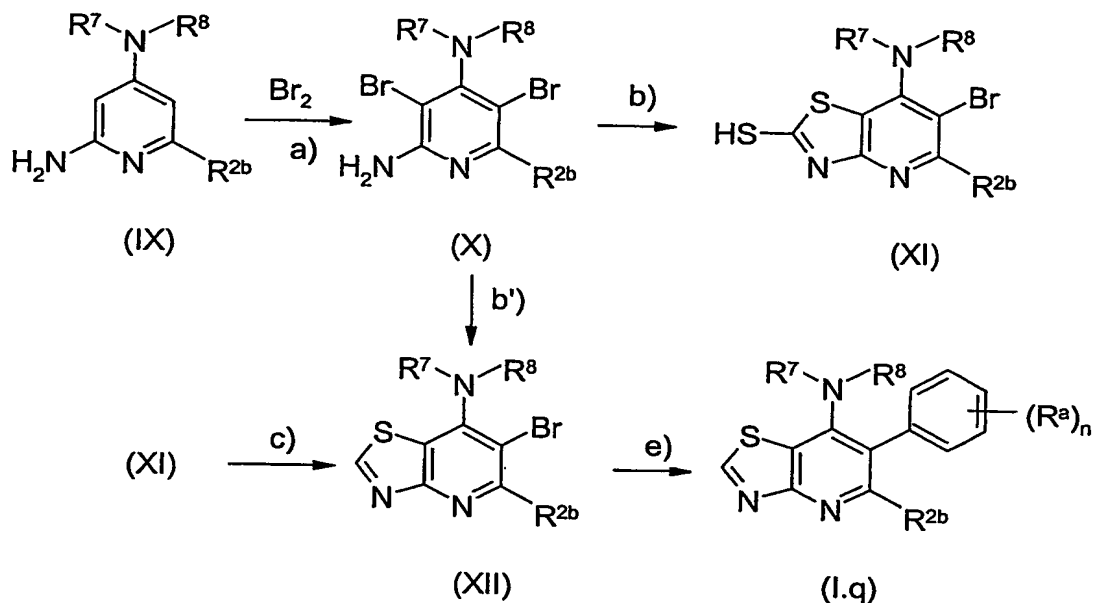
47

S. 1073-1077 und können in analoger Weise auf die Herstellung der Verbindungen I angewendet werden.

5 Verbindungen der allgemeinen Formel VIIa sind aus der WO 02/74753 grundsätzlich bekannt oder können nach den dort angegebenen Methoden hergestellt werden.

Verbindungen der allgemeinen Formel I.q, worin R^1 für NR^7R^8 , und R^2 für C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Haloalkyl oder C_3 - C_8 -Cycloalkyl stehen, können auch gemäß der in Schema 4 dargestellten Synthese hergestellt werden:

10



In Schema 5 haben n , R^a , R^7 , R^8 die zuvor genannten Bedeutungen. R^{2b} steht für C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Haloalkyl oder C_3 - C_8 -Cycloalkyl insbesondere für Methyl.

15

In Schritt a) wird eine Pyridinverbindung der allgemeinen Formel α bromiert, vorzugsweise unter sauren Reaktionsbedingungen, beispielsweise in Essigsäure nach der in J. Org. Chem. 1983, 48, S. 1064 angegebenen Methode. Hierbei erhält man ein 3,5-Dibrompyridin der allgemeinen Formel X.

20

Das 3,5-Dibrompyridin X wird dann in einem zweiten Schritt b) durch Umsetzung von X mit Ethylxanthogenat, z.B. $KSC(S)OC_2H_5$, zum 6-Mercaptothiazolo[4,5-b]pyridin der Formel XII cyclisiert, z.B. nach der in Synthetic Commun. 1996, 26, S. 3783 beschriebenen Methode. Mercaptothiazolo[4,5-b]pyridin XI wird anschließend in Schritt c) zum Thiazolo[4,5-b]pyridin XII reduziert, beispielsweise mit Raney-Nickel nach der von Metzger et al. in Bull. Soc. Chim. France, 1956, S. 1701 beschriebenen Methode. Alternativ kann man auch das 3,5-Dibrompyridin X direkt zum Thiazolo[4,5-b]pyridin XII cyclisieren (Schritt b'), z.B. nach der von N. Suzuki in Chem. and Pharm. Bull, 1979, 27(1) S. 1-11 beschriebenen Methode.

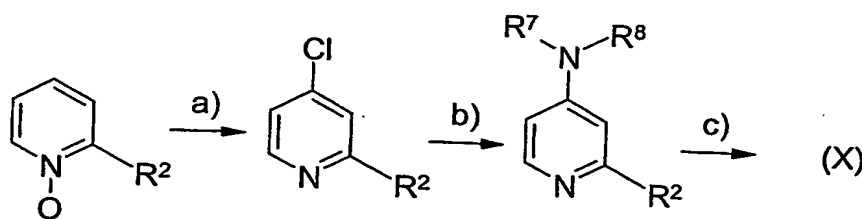
25

M/43373

Das so erhaltene Thiazolo[4,5-b]pyridin XII wird dann mit einer Phenylboronsäure-
verbindung der Formel VI unter den Bedingungen einer Suzuki-Reaktion nach der in
Schema 2 (s.o.) beschriebenen Methode umgesetzt, wobei man das 3-(substituiertes)-
5 Phenylthiazolo[4,5-b]pyridin I.q erhält.

Die Herstellung der Pyridinverbindung gelingt nach Standardverfahren der organischen
Chemie, beispielsweise nach der in Schema 6 dargestellten Synthese

10 Schema 6:



- 15 a): Umsetzung mit POCl₃ nach der in WO 96/39407 beschriebenen Methode;
b): Umsetzung mit HNR⁷R⁸ nach der in J. Org. Chem. 1984, 49, S.5237 beschriebe-
nen Methode;
c): Umsetzung mit NaNH₂ nach der in J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1 1990, S. 2409
beschriebenen Methode.

20 Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine her-
vorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen,
insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Oomyceten* und *Ba-
sidiomyceten*. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als
Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

25 Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an ver-
schiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Ba-
nanen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemü-
sepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an
30 den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
- 35 • *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,

49

- *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
- *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- 5 • *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten an Getreide,
- 10 • *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- *Uncinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- 15 • *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Pae-*
cilomyces variotii im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich,
Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu
schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid
wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch
nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

Die fungiziden Mittel enthalten im Allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise
zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des
gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 1 g,
vorzugsweise 0,01 bis 0,5 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an
Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effektes. Übliche Auf-
wandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise
0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

50

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiernmitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht: Lösungsmittel wie Aromaten (z.B. Xylol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol), Ketone (z.B. Cyclohexanon), Amine (z.B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und Wasser; Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiernmittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate und Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykoether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenoether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykoether, Tributylphenylpolyglykoether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoetheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol; Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser, in Betracht.

M/43373

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

- 5 Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, 10 Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nussschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

- 15 Die Formulierungen enthalten im Allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für Formulierungen sind:

- 20 I. 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 95 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 5 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 25 II. 30 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit einer Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit (Wirkstoffgehalt 23 Gew.-%).
- 30 III. 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 90 Gew.-Teilen Xylol, 6 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 2 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 2 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 9 Gew.-%).
- 35 IV. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 60 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 40 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooc-

tylphenol und 5Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 16 Gew.-%).

- 5 V. 80 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin- α -sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 7 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen (Wirkstoffgehalt 80 Gew.-%).
- 10 VI. Man vermischt 90 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl- α -pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist (Wirkstoffgehalt 90 Gew.-%).
- 15 VII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine wässrige Dispersion, die 20 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 25 VIII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin- α -sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 30 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.
- 35
- 40 Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereit werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-,

Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

5

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

10

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

15

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

20

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

25

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

30

- Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
- Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph,
- Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,
- Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,
- Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenconazole, Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,

35

- Dicarboximide wie Iprodion, Myclobutin, Procymidon, Vinclozolin,
- Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
- Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,
- Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
- Nitrophenyl-derivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl,
- Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
- Schwefel,
- Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Ferimzone, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid,
- Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
- Sulfensäure-derivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid,
- Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

Synthesebeispiele

Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in den anschließenden Tabellen mit physikalischen Angaben aufgeführt.

Beispiel 1: 7-Phenyl-8-isobutyl-6-methyl-[1,2,4]triazolo[4,3-b]pyridazin

1.1 7-Brom-8-isobutyl-6-methyl-[1,2,4]triazolo[4,3-b]pyridazin

Zu einer Lösung von 28,6 g (0,2 mol) 6-Methylheptan-2,4-dion in 120 ml Tetrachlormethan und 120 ml Wasser tropfte man bei 0 °C eine Lösung von 32 g (0,2 mol) Brom in 100 ml Tetrachlormethan. Nach beendeter Zugabe rührte man das Reaktionsgemisch noch 45 Minuten bei 0 °C nach. Man trennte die organische Phase ab, trocknete über wasserfreiem Magnesiumsulfat, filtrierte das Trockenmittel ab und engte das Lösungsmittel im Vakuum bis zur Trockne ein, wo-

55

bei man 44 g des bromierten Dions erhielt. Das erhaltenen rohe Zwischenprodukt löste man in 400 ml Eisessig, gab 16,8 g (0,2 mol) 1,2,4-Triazol-4-ylamin zu und erhitzte das Reaktionsgemisch 1,5 Stunden am Rückfluss. Man entfernte das organische Lösungsmittel und gab tert.-Butyl-methylether, Wasser und 1 N Natronlauge zu. Nach Phasentrennung trocknete man die organische Phase, filtrierte das Trockenmittel ab und engte das Lösungsmittel im Vakuum bis zur Trockne ein, wobei man ein dunkles Öl erhielt. Das erhaltene Öl reinigte man durch Chromatographie an Kieselgel (Eluierungsmittel: Cyclohexan + Essigsäureethylester 2:1 v/v), wobei man 6,6 g 7-Brom-8-isobutyl-6-methyl-[1,2,4]triazolo[4,3-b]pyridazin als viskoses Öl erhielt.

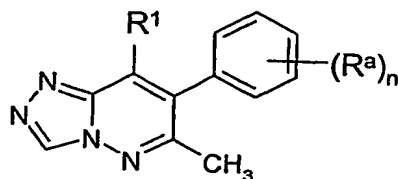
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ [ppm]: 1,0 (d, 6H), 2,5 (m, 1H), 2,7 (s, 3H), 3,2 (d, 2H), 9,0 (s, 1H).

1.2 7-Phenyl-8-isobutyl-6-methyl-[1,2,4]triazolo[4,3-b]pyridazin

Man erhitzte ein Gemisch aus 0,5 mmol 7-Brom-8-isobutyl-6-methyl-[1,2,4]triazolo[4,3-b]pyridazin aus Beispiel 5.1, 0,75 mmol Phenylboronsäure, 1,5 mmol Natriumhydrogencarbonat und 0,03 mmol Tetrakis-(triphenylphosphin)-palladium(0) in 5 ml Tetrahydrofuran und 2 ml Wasser 24 Stunden am Rückfluss. Danach ließ man das Reaktionsgemisch auf Raumtemperatur abkühlen und filtrierte über Celite. Das Filtrat engte man im Vakuum bis zur Trockne ein und reinigte den so erhaltenen Rückstand durch Säulenchromatographie an Kieselgel (Eluierungsmittel: Cyclohexan + Essigsäureethylester, wobei man 0,08 g der Titelverbindung erhielt.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ [ppm]: 0,8 (d, 2H), 2,2 (s, 3H), 2,4 (m, 1H), 2,7 (d, 2H), 7,2 (d, 2H), 7,5 (m, 3H), 9,0 (s, 1H).

In analoger Weise wurden die in der nachstehenden Tabelle 1 angegebenen Verbindungen der allgemeinen Formel I.c ($\text{R}^{3a}=\text{H}$) hergestellt:



(I.c)

Tabelle 1:

Beispiel	R ¹	C ₆ H _{5-n} (R ^a) _n	¹ H-NMR (CDCl ₃) [δ] bzw. Schmelzpunkt [°C]
2	2-Methylpropyl	2-Methyl-4-fluorphenyl	9,05(s), 7,10(m), 2,95(dd), 2,45(m), 2,20(s), 2,05(s), 1,90(d), 1,75(d)
3	n-Butyl	2-Methyl-4-fluorphenyl	9,05(s), 7,10(m), 2,85(m), 2,55(m), 2,20(s), 2,10(s), 1,75(m), 1,35(m), 1,80(t)
4	n-Butyl	2,4-Difluorphenyl	9,05(s), 7,20(m), 7,05(m), 2,85(f), 1,70(m), 1,30(m), 1,80(f)
5	n-Butyl	2-Fluor-4-methylphenyl	9,00(s), 7,15(m), 2,85(m), 2,50(s), 2,30(s), 1,70(m), 1,30(m), 1,80(f)
6	2-Methylpropyl	2,4-Difluorphenyl	92°C
7	2-Methylpropyl	2-Fluor-4-methylphenyl	9,05(s), 7,10(m), 2,75(m), 2,50(f), 2,30(s), 1,65(d), 1,60(d)

Beispiel 8: 5-Chlor-6-(2-chlor-6-fluorphenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-tetrazolo-[1,5-a]pyrimidin

5

8.1. 5,7-Dihydroxy-6-(2-chlor-6-fluorphenyl)tetrazolo[1,5-a]pyrimidin

10

Eine Mischung aus 5-Aminotetrazol (0,15 mol), 2-Aminotetrazol (0,15 mol), 2-(2-chlor-6-fluorphenyl)malonsäurediethylester (0,15 mol) und Tributylamin (50 ml) wurde 6 Stunden auf 180°C erwärmt. Man kühlte die Reaktionsmischung auf 70°C, gab eine Lösung von 21 g Natriumhydroxid in 22 ml Wasser zu und rührte die Mischung 30 Minuten. Man trennte die organische Phase ab und extrahierte die wässrige Phase mit Diethylether. Man säuerte die wässrige Phase mit konzentrierter Salzsäure an. Der Niederschlag wurde abfiltriert und getrocknet, wobei man 7 g des Produkts erhielt.

15

8.2. 5,7-Dichlor-6-(2-chlor-6-fluorphenyl)tetrazolo[1,5-a]pyrimidin

20

Eine Mischung aus 5,7-Dihydroxy-6-(2-chlor-6-fluorphenyl)tetrazolo[1,5-a]pyrimidin (6 g), aus Beispiel 8.1) und Phosphoroxychlorid (20 ml) wurde 8 Stunden zum Rückfluss erhitzt. Anschließend wurde Phosphoroxychlorid teilweise abdestilliert. Der Rückstand wurde in eine Mischung aus Dichlormethan und Wasser gegossen. Man trennte die organische Phase ab, trocknete sie mit wasserfreiem Natriumsulfat und filtrierte. Das Hydrat wurde im Vakuum eingeeengt, wobei man 4 g der Titelverbindung erhielt.

25

8.3. 5-Chlor-6-(2-chlor-6-fluorphenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)tetrazolo[1,5-a]pyrimidin

5 Eine Mischung von 4-Methylpiperidin (1,5 mmol), Triethylamin (1,5 mmol) und Dichlormethan (10 ml) gab man zu einer Mischung von 5,7-Dichlor-6-(2-chlor-6-fluorphenyl)tetrazolo[1,5-a]pyrimidin (1,5 mmol, aus Beispiel 8.2) und Dichlormethan (20 ml) unter Rühren. Man rührte die Mischung 16 Stunden bei Raumtemperatur und wusch anschließend mit verdünnter Salzsäure (5 %). Man trennte die organische Phase ab, trocknete mit wasserfreiem Natriumsulfat und filtrierte. Man engte das Filtrat unter vermindertem Druck ein und reinigte den Rückstand durch Säulenchromatographie an Kieselgel, wobei man 0,26 g des Produkts erhielt.

Beispiel 9: 7-Chlor-5-isopropylamino-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]pyrimidin

15 9.1. 6-Chlor-2-hydrazino-4-isopropylamino-5-(2,4,6-trifluorphenyl)pyrimidin

Man suspendierte 16,3 g (43 mmol) 6-Chlor-4-isopropylamino-2-methylsulfonyl-5-(2,4,6-trifluorphenyl)pyrimidin in 50 ml Ethanol, gab hierzu 5,3 g (0,17 mol) Hydrazinhydrat und erwärmte unter Rühren 90 Minuten zum Rückfluss. Anschließend engte man die Reaktionsmischung unter vermindertem Druck ein, nahm den Rückstand mit Ethanol auf, trocknete über Natriumsulfat und engte erneut ein. Anschließend reinigte man den Rückstand mittels Säulenchromatographie an Kieselgel (Eluent: Cyclohexan: Essigsäureethylester (2:1)). Man erhielt so 14,2 g des Produkts als hellgelben Feststoff. Schmelzpunkt 143-150°C.

25 9.2. N,N-Dimethyl-N'-(4-chlor-6-isopropylamino-5-(2,4,6-trifluorphenyl)pyrimidin-2-yl)hydrazonoformamid

30 Zu einer Lösung 1,0 g (3 mmol) des Hydroazinopyrimidins aus 9.1 in 10 ml Tetrahydrofuran gab man 6 ml Dimethoxymethyldimethylamin, rührte 16 h bei Raumtemperatur und 2 h unter Rückfluss. Man engte die Reaktionsmischung im Vakuum ein und reinigte den Rückstand anschließend chromatographisch an Kieselgel (Eluent: Cyclohexan, Essigsäureethylester (2:1)). Man erhielt so 0,6 g des Produkts als hellbraunen Feststoff mit einem Schmelzpunkt von 204 bis 207°C.

35 9.3. 7-Chlor-5-isopropylamino-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]pyrimidin

40 Man löste 0,25 g (0,65 mmol) der Pyrimidinverbindung aus 9.2. in 12,5 ml Tetrahydrofuran. Hierzu gab man 0,2 g (3,3 mmol) Essigsäure, rührte 15 h bei Raumtemperatur und 2 h bei 40°C und 60°C und engte anschließend unter vermindertem Druck ein. Der Rückstand wurde an Kieselgel chromatographisch gereinigt (Eluent: Cyclohexan, Methyl-tert.-butylether (2:1)). Man erhielt so 0,18 g des Produkts als beigefarbenen Feststoff mit einem Schmelzpunkt von 268 bis 273°C.

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der allgemeinen Formel I ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

5

Die Wirkstoffe wurden als Stammlösung aufbereitet mit 0,25 Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder DMSO. Dieser Lösung wurde 1 Gew.-% Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) zugesetzt und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

10

Wirksamkeit gegen die Dürrfleckenkrankheit der Tomate verursacht durch *Alternaria solani* bei protektiver Anwendung

15

Blätter von Topfpflanzen der Sorte "Große Fleischtomate St. Pierre" wurden mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wässrigen Sporenschwemmung von *Alternaria solani* in 2 % Biomalzlösung mit einer Dichte von 0.17×10^6 Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampf-gesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C aufgestellt. Nach 5 Tagen hatte sich die Krautfäule auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

20

25 Tabelle 2:

Wirkstoff-Nr	Befall [%] bei 250 ppm
Beispiel 1	10
Beispiel 2	15
Beispiel 3	25
Beispiel 4	10
Beispiel 7	20
Unbehandelt	80

30

Beispiel 2: Wirksamkeit gegen Rebenperonospora verursacht durch *Plasmopara viticola* bei protektiver Anwendung

35

Blätter von Topfreben der Sorte "Müller-Thurgau" wurden mit wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Unterseiten der Blätter mit einer wässrigen Zoosporenschwemmung von *Plasmopara viticola* inokuliert. Danach wurden die Reben zunächst für 48 Stunden in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei 24° C und anschließend

für 5 Tage im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 30°C aufgestellt. Nach dieser Zeit wurden die Pflanzen zur Beschleunigung des Sporangienträgerausbruchs abermals für 16 Stunden in eine feuchte Kammer gestellt. Dann wurde das Ausmaß der Befallsentwicklung auf den Blattunterseiten visuell ermittelt.

5

Tabelle 3:

Wirkstoff-Nr	Befall [%] bei 250 ppm
Beispiel 1	20
Beispiel 2	0
Beispiel 3	0
Beispiel 4	0
Beispiel 5	0
Beispiel 6	0
Unbehandelt	90

Beispiel 3 – Wirksamkeit gegen Weizenmehltau verursacht durch *Erysiphe* [syn. *Blumeria*] *graminis* forma specialis *tritici* bei protektiver Anwendung

10

Blätter von in Töpfen gewachsenen Weizenkeimlingen der Sorte "Newton" wurden mit wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Die Suspension oder Emulsion wurde durch Verdünnung mit Wasser aus einer Stammlösung mit 5 % Anteil Wirkstoff, 94 % Cyclohexanon und 1 % Emulgiermittel (Tween 20) hergestellt. 3 - 5 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages mit Sporen des Weizenmehltaus (*Erysiphe* [syn. *Blumeria*] *graminis* forma specialis. *tritici*) bestäubt. Die Versuchspflanzen wurden anschließend im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 24 °C und 60 bis 90 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt. Nach 7 Tagen wurde das Ausmaß der Mehltauentwicklung visuell in % Befall der gesamten Blattfläche ermittelt.

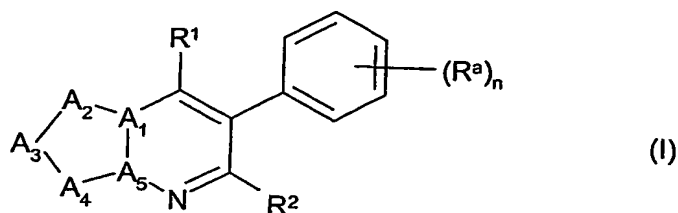
15
20

Tabelle 4

Wirkstoff-Nr	Befall [%] bei 250 ppm
Beispiel 8	15
Unbehandelt	90

Patentansprüche

1. Bicyclische Verbindungen der allgemeinen Formel 1



worin

A_1 oder A_5 für C steht und die andere der beiden Variablen A_1 , A_5 für N, C oder C- R^3 steht;

A_2 , A_3 , A_4 unabhängig voneinander für N oder C- R^{3a} stehen, wobei eine der Variablen A_2 , A_3 oder A_4 auch für S oder eine Gruppe N- R^4 stehen kann, wenn A_1 und A_5 beide für C stehen, und wobei A_4 nicht N oder C- R^{3a} bedeutet, wenn A_1 für N, A^3 für C- R^{3a} und A_5 für C stehen, und worin

A_1 mit A_2 und A_3 mit A_4 oder

A_2 mit A_3 und A_4 mit A_5 oder

A_1 mit A_5 und A_2 mit A_3 oder

A_1 mit A_5 und A_3 mit A_4 oder

A_1 mit A_2 und A_4 mit A_5 durch Doppelbindungen miteinander verbunden sind;

n für 0, 1, 2, 3, 4 oder 5 steht;

R^a für Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Haloalkyl, C₁-C₆-Haloalkoxy, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy oder C(O) R^5 steht; Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Haloalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₅-C₈-Cycloalkenyl, OR⁶, SR⁶ oder NR⁷R⁸ bedeuten;

R^2 Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Haloalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₅-C₈-Cycloalkenyl, OR⁶, SR⁶ oder NR⁷R⁸ bedeuten;

R^3 , R^{3a} unabhängig voneinander für Wasserstoff, CN, Halogen, C₁-C₆-Alkyl oder C₂-C₆-Alkenyl stehen;

R^4 Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₂-C₆-Alkenyl bedeutet;

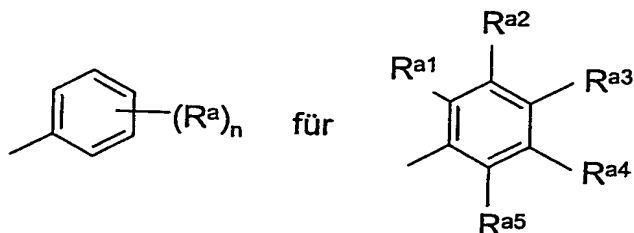
R^5 Wasserstoff, OH, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Haloalkyl, C₁-C₆-Haloalkoxy, C₂-C₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkylamino oder Di-C₁-C₆-alkylamino, Piperidin-1-yl, Pyrrolidin-1-yl oder Morpholin-4-yl bedeutet;

R^6 Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Haloalkyl, C₂-C₆-Alkenyl oder COR⁹ bedeutet;

- 5 R^7, R^8 unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_4 - C_{10} -Alkadienyl, C_2 - C_{10} -Alkynyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_5 - C_8 -Cycloalkenyl, C_5 - C_{10} -Bicycloalkyl, Phenyl, Naphthyl, ein 5- oder 6-gliedriger, gesättigter oder teilweise ungesättigter Heterocyclus, der 1, 2 oder 3 Heteroatome, ausgewählt unter N, O und S, als Ringglieder aufweisen kann, oder ein 5- oder 6-gliedriger, aromatischer Heterocyclus, der 1, 2 oder 3 Heteroatome, ausgewählt unter N, O und S, als Ringglieder aufweisen kann,
- 10 wobei die als R^7, R^8 genannten Reste teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder 1, 2 oder 3 Reste R^b aufweisen können, wobei
- 15 R^b ausgewählt ist unter Cyano, Nitro, OH, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_1 - C_6 -Haloalkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, C_2 - C_6 -Alkynyl, C_2 - C_6 -Alkynyloxy, C_1 - C_6 -Alkylamino, Di- C_1 - C_6 -alkylamino, Piperidin-1-yl, Pyrrolidin-1-yl oder Morpholin-4-yl;
- 20 R^7 mit R^8 auch gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-, 6 oder 7-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus bilden können, der 1, 2, 3 oder 4 weitere Heteroatome, ausgewählt unter O, S, N und NR^{10} als Ringglied aufweisen kann, der teilweise oder vollständig halogeniert sein kann und der 1, 2 oder 3 der Reste R^b aufweisen kann; und
- 25 R^9, R^{10} unabhängig voneinander Wasserstoff oder C_1 - C_6 -Alkyl bedeuten; sowie die landwirtschaftlich verträglichen Salze von Verbindungen I,
- 30 ausgenommen Verbindungen der allgemeinen Formel I worin R^1 und R^2 gleichzeitig für OH oder gleichzeitig für Halogen stehen, wenn A_1 für N und A_5 für C stehen.
- 35 2. Verbindungen nach Anspruch 1 der allgemeinen Formel I, worin A_1 für C und A_5 für N stehen und A_2, A_3 und A_4 unabhängig voneinander N oder $C-R^{3a}$ bedeuten.
- 40 3. Verbindungen nach Anspruch 2 der allgemeinen Formel I, worin A_2 für N steht.
4. Verbindungen nach Anspruch 1 der allgemeinen Formel I, worin A_1 und A_3 für N stehen, A_5 für C steht und A_2 und A_4 unabhängig voneinander N oder $C-R^{3a}$ bedeuten.
5. Verbindungen nach Anspruch 1 der allgemeinen Formel I, worin A_1 für N und A_5 für C stehen, und A_2, A_3 und A_4 unabhängig voneinander $C-R^{3a}$ bedeuten.
6. Verbindungen nach Anspruch 1 der allgemeinen Formel I, worin A_1 und A_5 für C stehen, eine der Variablen A_2 oder A_4 für Schwefel steht und die beiden verblei-

benden Variablen A_2 oder A_4 sowie die Variable A_3 unabhängig voneinander $C-R^{3a}$ oder N bedeuten.

- 5 7. Verbindungen nach einem der vorhergehenden Ansprüche der allgemeinen Formel I, worin n für 1, 2, 3 oder 4 steht.
8. Verbindungen nach einem der vorhergehenden Ansprüche der allgemeinen Formel I, worin die Gruppe



steht, worin

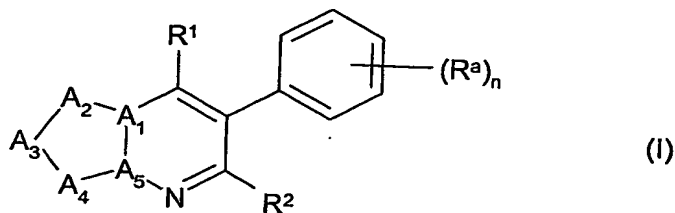
- R^{a1} für Fluor, Chlor oder Methyl;
 R^{a2} für Wasserstoff oder Fluor;
 R^{a3} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy;
 R^{a4} für Wasserstoff oder Fluor;
 R^{a5} für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder C_1 - C_4 -Alkyl stehen.

9. Verbindungen nach einem der vorhergehenden Ansprüche der allgemeinen Formel I, worin R^1 für eine Gruppe NR^7R^8 steht, worin wenigstens einer der Reste R^7 , R^8 von Wasserstoff verschieden ist.
10. Verbindungen nach Anspruch 9 der allgemeinen Formel I, worin
 R^7 für C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_2 - C_6 -Alkinyl oder C_2 - C_6 -Alkenyl steht;
 R^8 für Wasserstoff oder C_1 - C_6 -Alkyl steht; oder
 R^7 , R^8 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gesättigten oder teilweise ungesättigten Stickstoffheterocyclus stehen, der 1 weiteres Heteroatom, ausgewählt unter O, S, und NR^{10} als Ringglied aufweisen kann, und der 1 oder 2 Substituenten, ausgewählt unter C_1 - C_6 -Alkyl und C_1 - C_6 -Haloalkyl, aufweisen kann, wobei R^{10} die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung aufweist.
10. Verbindungen nach Anspruch 9 oder 10 der allgemeinen Formel I, worin R^2 für Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl steht.
11. Verbindungen nach einem der vorhergehenden Ansprüche der allgemeinen Formel I, worin R^1 für C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkinyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl oder C_3 - C_8 -Cycloalkenyl steht und R^2 für C_1 - C_4 -Alkyl steht.

12. Verwendung von Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 11 und von deren landwirtschaftlich verträglichen Salzen zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen.
- 5 13. Mittel zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen, enthaltend wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 11 und/oder ein landwirtschaftlich verträgliches Salz von I und wenigstens einen flüssigen oder festen Trägerstoff.
- 10 14. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 11 und/oder mit einem landwirtschaftlich verträglichen Salz von I behandelt.

Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft bicyclische Verbindungen der allgemeinen Formel 1



worin

A₁ oder A₅ für C steht und die andere der beiden Variablen A₁, A₅ für N, C oder C-R³ steht;

A₂, A₃, A₄ unabhängig voneinander für N oder C-R^{3a} stehen, wobei eine der Variablen A₂, A₃ oder A₄ auch für S oder eine Gruppe N-R⁴ stehen kann, wenn A₁ und A₅ beide für C stehen, und wobei A₄ nicht N oder C-R^{3a} bedeutet, wenn A₁ für N, A³ für C-R^{3a} und A₅ für C stehen, und worin

A₁ mit A₂ und A₃ mit A₄ oder
A₂ mit A₃ und A₄ mit A₅ oder

A₁ mit A₅ und A₂ mit A₃ oder

A₁ mit A₅ und A₃ mit A₄ oder

A₁ mit A₂ und A₄ mit A₅ durch Doppelbindungen miteinander verbunden sind;

n für 0, 1, 2, 3, 4 oder 5 steht;

R^a für Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Haloalkyl, C₁-C₆-Haloalkoxy, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy oder C(O)R⁵ steht;

R¹ Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Haloalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₅-C₈-Cycloalkenyl, OR⁶, SR⁶ oder NR⁷R⁸ bedeuten;

R² Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Haloalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₅-C₈-Cycloalkenyl, OR⁶, SR⁶ oder NR⁷R⁸ bedeuten;

sowie die landwirtschaftlich verträglichen Salze von Verbindungen I, Pflanzenschutzmittel, enthaltend wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel I und/oder landwirtschaftlich verträgliches Salz von I und wenigstens einen flüssigen oder festen Trägerstoff sowie ein Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.